



PCT
WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation ⁶ :C07C 237/44, 235/58, 235/64, 235/62,
A01N 37/18, 37/24

A1

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 97/08135

(43) Internationales
Veröffentlichungsdatum:

6. März 1997 (06.03.97)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP96/03637

(22) Internationales Anmeldedatum: 19. August 1996 (19.08.96)

(30) Prioritätsdaten:

195 31 891.9	30. August 1995 (30.08.95)	DE
196 15 453.7	19. April 1996 (19.04.96)	DE
196 26 311.5	1. Juli 1996 (01.07.96)	DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER
AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen
(DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SEITZ, Thomas [DE/DE];
Rietherbach 10b, D-40764 Langenfeld (DE). NAUMANN,
Klaus [DE/DE]; Richard-Wagner-Strasse 9, D-51375 Lev-
erkusen (DE). TIEMANN, Ralf [DE/DE]; Ernst-Ludwig-
Kirchner-Strasse 5, D-51375 Leverkusen (DE). STENZEL,
Klaus [DE/DE]; Seesener Strasse 17, D-40595 Düsseldorf
(DE). HÄNSSLER, Gerd [DE/DE]; Am Arenzberg 58a, D-
51381 Leverkusen (DE). DUTZMANN, Stefan [DE/DE];
Kosenberg 10, D-40721 Hilden (DE).(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGE-
SELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).(81) Bestimmungsstaaten: AU, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CZ,
HU, JP, KR, KZ, LK, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SK,
TR, UA, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI
Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE,
SN, TD, TG).

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

(54) Title: ACYLAMINOSALICYLIC ACID AMIDES AND THEIR USES AS PESTICIDES

(54) Bezeichnung: ACYLAMINOSALICYLSÄUREAMIDE
SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL

UND

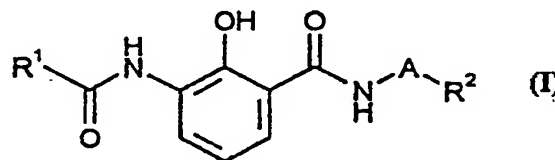
IHRE

VERWENDUNG

ALS

(57) Abstract

Known and new acylaminosalicylic acid amides are disclosed having the general formula (I), as well as several processes for producing the same, their use as pesticides, new intermediate products and several processes for preparing said intermediate products. In the formula (I), A stands for a simple bond or for an alkylene chain; R¹ stands for hydrogen, alkyl or alkoxy; R² stands for optionally substituted cycloalkyl, cycloalkenyl, aryl or heterocyclyl.



(57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft bekannte und neue Acylaminosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (I), mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel, sowie neue Zwischenprodukte und mehrere Verfahren zu deren Herstellung, in welcher A für eine Einfachbindung oder für eine Alkylenkette steht, R¹ für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxy steht, R² für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl oder Heterocyclyl steht.

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表平11-511442

(43) 公表日 平成11年(1999)10月5日

(51) Int.Cl. ⁶	識別記号	F I
C 0 7 C 237/42		C 0 7 C 237/42
A 0 1 N 37/24		A 0 1 N 37/24
43/08		43/08 A
43/10		43/10 A
C 0 7 C 235/60		C 0 7 C 235/60
審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 139 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号 特願平9-509794
 (86) (22) 出願日 平成8年(1996)8月19日
 (85) 翻訳文提出日 平成10年(1998)2月23日
 (86) 国際出願番号 PCT/EP96/03637
 (87) 国際公開番号 WO97/08135
 (87) 国際公開日 平成9年(1997)3月6日
 (31) 優先権主張番号 19531891.9
 (32) 優先日 1995年8月30日
 (33) 優先権主張国 ドイツ (DE)
 (31) 優先権主張番号 19615453.7
 (32) 優先日 1996年4月19日
 (33) 優先権主張国 ドイツ (DE)

(71) 出願人 バイエル・アクチエンゲゼルシャフト
 ドイツ連邦共和国デー51368レーフェルク
 ーゼン
 (72) 発明者 ザイツ, トマス
 ドイツ連邦共和国デー40764ランゲンフ
 エルト・リーターバツハ10ペー
 (72) 発明者 ナウマン, クラウス
 ドイツ連邦共和国デー51375レーフェルク
 ーゼン・リヒャルト・バグナー・シユト
 ラーセ9
 (74) 代理人 弁理士 小田島 平吉 (外1名)

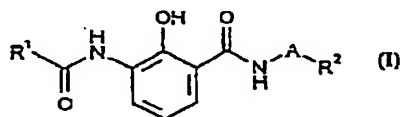
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 アシルアミノサリチル酸アミドおよびそれらの有害生物防除剤としての使用

(57) 【要約】

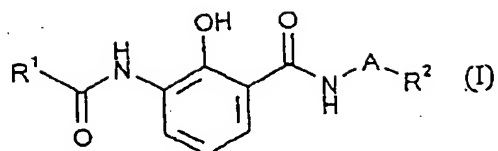
一般式 (I) を有する既知の、および新規のアシルアミノサリチル酸アミド、ならびにそれらの幾つかの製造法、有害生物防除剤としての使用、新規中間生成物および該中間体生成物の幾つかの製造法を開示する。式

(I) において、Aは単結合またはアルキレン鎖を表し；R¹は水素、アルキルまたはアルコキシを表し；R²は場合によっては置換されてもよいシクロアルキル、シクロアルケニル、アリールまたはヘテロシクリルを表す。



【特許請求の範囲】

1. 式 (I)



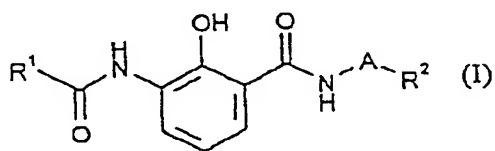
式中、

Aは、単結合またはアルキレン鎖を表し、

R¹は、水素、アルキルまたはアルコキシを表し、

R²は、各々が場合によっては置換されてもよいシクロアルキル、シクロアルケニル、アリールまたはヘテロシクリルを表す、
の化合物の植物および工業材料上の有害生物を防除するための使用。

2. 一般式 (I)



式中、

Aは、単結合または場合によっては置換されてもよいアルキレンを表し、

R¹は、水素、アルキルまたはアルコキシを表し、

R²は、各々が場合によっては置換されてもよいシクロアルキル、シクロアルケニル、アリールまたはヘテロシクリルを表すが、置換基としてニトロ基は除き

、
そして化合物 3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-N-(4-[2,4,6-トリス-(1-メチルプロピル)-フェノキシ]-フェニル)-ベンズアミド、N-(4-[3,5

-ビス-(1,1-ジメチルエチル)-フェノキシ]-フェニル)-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-ベンズアミド、N-(4-[2,4-ビス-(1,1-ジメチルエチル)フェノキシ]-フェニル)-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-ベンズアミド、N-(4-[2,6-ビス-(1-

メチルプロピル)-フェノキシ]-フェニル)-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-ベンズアミド、3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-N-{4-[3-トリフルオロメチル)-フェノキシ]フェニル}-ベンズアミド、N-{4-[4-(1,1-ジメチルエチル)-フェノキシ]-フェニル)-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-ベンズアミド、3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-N-(4-フェノキシフェニル)-ベンズアミド、N-(4-ブチルフェニル)-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-ベンズアミドおよびN-{3-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル)-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-ベンズアミド、3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-N-(フェニルメチル)-ベンズアミド、3-ホルミルアミド-サリチルアニリドおよび3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-N-(2-フェニルエチル)-ベンズアミドを除外する、化合物。

3. Aが単結合または1-6個の炭素原子を有するアルキレン鎖を表し、

R¹が水素、各々1-4個の炭素原子を有するアルキルまたはアルコキシを表し、

R²は、各々が3-12個の炭素原子を有し、そして各々が場合によってはハロゲン、シアノ、カルボキシル、フェニル（これは場合によってはハロゲン、シアノ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロゲンアルキル、C₁-C₄-アルコキシまたはC₁-C₄-ハロゲンアルコキシにより置換されてもよい）、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシカルボニルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換また

は多置換されてもよいシクロアルキルまたはシクロアルケニルを表すか、あるいは

3-12個の環の員を有するアリール、または3-8個の環の員を有するヘテロシクリルを表し、これらアリールまたはヘテロシクリルは置換基をもつことができ、同一または異なる置換基により単置換または多置換されることができ、可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

ハロゲン、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル；

直鎖または分枝のアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニ

ルまたはアルキルスルホニルの各々の場合、各々が1-6個の炭素原子を有し；

直鎖または分枝のアルケニルまたはアルケニルオキシの各々の場合、各々が2-6個の炭素原子を有し；

直鎖または分枝のハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルキルチオ、ハロゲノアルキルスルフィニルまたはハロゲノアルキルスルホニル各々の場合各々が1-6個の炭素原子および1-13個の同一または異なるハロゲン原子を有し；

直鎖または分枝のハロゲノアルケニルまたはハロゲノアルケニルオキシの各々の場合、各々が2-6個の炭素原子および1-13個の同一または異なるハロゲン原子を有し；

直鎖または分枝のアシルアミノ、N-アシル-N-アルキルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニルオキシ、

ヒドロキシミノアルキルまたはアルコキシミノアルキルの各々の場合、各々が1-6個の炭素原子を個々のアルキル部分に有し；

二価のアルキレンまたはジオキシアルキレンの各々の場合、各々が1-6個の炭素原子を有し、そして各々が場合によっては、ハロゲンおよび/または1-4個の炭素原子を有する直鎖もしくは分枝アルキルおよび/または1-4個の炭素原子および1-9個の同一もしくは異なるハロゲン原子を有する直鎖もしくは分枝ハロゲノアルキル；

3-6個の炭素原子を有するシクロアルキル；

ならびに各々が以下の、

ハロゲン、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル

から成る群から同一または異なる置換基により、場合により単置換または多置換されてもよい、アリール、アリールオキシ、アリールチオ、アリールアルキル、アリールアルキルチオ、アリールオキシアルキル、アリールチオアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリルチオ、ヘテロシクリルア

ルキル、ヘテロシクリルアルキルオキシまたはヘテロシクリルアルキルチオ；から成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよく；

直鎖または分枝のアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニルまたはアルキルスルホニルの各々の場合、各々が1－6個の炭素原子を有し；

直鎖または分枝のアルケニルまたはアルケニルオキシの各々の場合、各々が2－6個の炭素原子を有し；

直鎖または分枝のハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルキルチオ、ハロゲノアルキルスルフィニルまたはハロゲノアルキルスルホニルの各々の場合、各々が1－6個の炭素原子および1－13個の同一または異なるハロゲン原子を有し、；

直鎖または分枝のハロゲノアルケニルまたはハロゲノアルケニルオキシの各々の場合、各々が2－6個の炭素原子および1－13個の同一または異なるハロゲン原子を有し；

直鎖または分枝のアシルアミノ、N-アシル-N-アルキルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニルオキシ、ヒドロキシミノアルキルまたはアルコキシミノアルキルの各々の場合、各々が1－6個の炭素原子を個々のアルキル部分に有し；

二価のアルキレンまたはジオキシアルキレンの各々の場合、各々が1－6個の炭素原子を有し、そして各々が場合によっては、ハロゲンおよび／または1－4個の炭素原子を有する直鎖もしくは分枝アルキルおよび／または1－4個の炭素原子および1－9個の同一もしくは異なるハロゲン原子を有する直鎖もしくは分枝ハロゲノアルキルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよく；あるいは

3－6個の炭素原子を有するシクロアルキル、
の請求の範囲第2項に記載の式（I）の化合物。

4. Aが単結合またはメチレン、1,1-エチレン、1,2-エチレン、1,1-, 1,2-, 1,3-もしくは2,2-プロピレン、1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-

2,2-, 2,3-ブチレンまたは1,1-, 1,2-もしくは1,3-(2-メチル-プロピレン)を表し、

R¹が、水素、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-, i-, s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシを表し；

R²は各々が場合によってはフッ素、塩素、臭素、シアノ、カルボキシル、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロピル、メトキシ-カルボニルまたはエトキシ-カルボニルにより単置換から六置換されてもよい、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル、シクロウンデシル、シクロドデシル、テトラリニル、デカリニル、シクロドデカトリエニル、インダニル、ノルボルニルまたはアダマンチルを表すか；あるいは

各々が場合によっては単置換から三置換されてもよいフェニル、ナフチル、ベンジル、フェネチル、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、インドリル、チエニル、ベンゾチエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジル、キノリル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、オキシラニル、オキセタニル、テトラヒドロフリル、ペルヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニルまたはモルホリニルを表し、可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

フッ素、塩素、臭素、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-, i-, s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エト

キシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキ

シ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、ヒドロキシミノメチル、ヒドロキシミノエチル、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルまたはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換から四置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、

ならびに/または各々が以下の、

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-、s-も

しくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノ

エチルもしくはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、ならびに

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、

から成る群からの同一または異なる置換基により場合によっては単置換から四置換されてもよく、各々が個々のアルキル鎖に1-4個の炭

素原子を有するフェニル、フェノキシ、フェニルアルキル、フェニルチオ、フェノキシアルキル、フェニルチオアルキル、フェニルアルキルオキシまたはフェニルアルキルチオ、

の請求の範囲第2項に記載の式(I)の化合物。

5. Aが単結合またはメチレン、1,1-エチレン、1,2-エチレン、1,1-, 1,2-, 1,3-もしくは2,2-プロピレン、1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-ブチレンまたは1,1-, 1,2-もしくは1,3-(2-メチル-プロピレン)を表し、

R¹が、水素、メチル、エチル、メトキシまたはエトキシを表し、

R²は各々が場合によってはフッ素、塩素、臭素、シアノ、カルボキシル、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロピル、メトキシ-カルボニルまたはエトキシ-カルボニルにより単置換から六置換されてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル、シクロウンデシル、シクロドデシル、テトラリニル、カリニル、シクロドデカトリエニル、インダニル、ノルボルニルまたはアダマンチルを表すか、あるいは

各々の場合で場合によっては単置換から三置換されてもよいフェニル、ナフチル、ベンジル、フェネチル、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、インドリル、チエニル、ベンゾチエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジル、キノリル、ピリミ

ジル、ピリダジニル、ピラジニル、オキシラニル、オキセタニル、テトラヒドロ
フリル、ペルヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニルまたはモルホリニル
を表

し、可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、
メチル、エチル、n-もしくは i-プロピル、n-、i-、s-もしくは t-ブチル、メト
キシ、エトキシ、n-もしくは i-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくは
i-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニ
ルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフ
ルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフル
オロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフル
オロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチル
スルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、
メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくは i-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、
ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニ
ル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、
メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルまたはエトキシ
ミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルお
よびn-もしくは i-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換
から四置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイ
ル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジ
オキシ、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、

ならびに／または各々が以下の、

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル
、メチル、エチル、n-もしくは i-プロピル、n-、i-、s-もしくは t-ブチル、メト

キシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n*-もしくは*i*-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、*N*-ホルミル-*N*-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、*n*-もしくは*i*-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルもしくはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよび*n*-もしくは*i*-プロピルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1, 3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1, 4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、ならびに

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキ

シル、

から成る群からの同一または異なる置換基により、場合によっては単置換から四置換されてもよいフェニル、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジル、フェニルエチル、フェニルプロピル、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、フェノキシメチル、フェノキシエチル、フェニルチオメチルまたはフェニルチオエチル、

の請求の範囲第2項に記載の式(I)の化合物。

6. Aが単結合またはメチレン、1,1-エチレン、1,2-エチレン、1,1-プロピレン、1,2-プロピレンまたは2,2-プロピレンを表し、

R¹が水素を表し；

R²は各々が場合によってはメチル、エチル、メトキシまたはエトキシにより単

置換または二置換されてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル、シクロウンデシル、シクロドデシル、テトラリニル、デカリニル、シクロドデカトリエニル、インダニル、ノルボルニルまたはアダマンチルを表すか、あるいは

各々の場合で場合によっては単置換から三置換されてもよいフェニル、ナフチル、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、インドリル、チエニル、ベンゾチエニル、ビリジル、キノリル、ビリミジル、ビリダジニルまたはピラジニルを表し、そして可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロ

ポキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n*-もしくは*i*-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、*N*-ホルミル-*N*-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、*n*-もしくは*i*-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルもしくはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよび*n*-もしくは*i*-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換から四置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

ならびに／または各々が以下の、

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチル

スルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルもしくはエトキシミノエチル、ならびに

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1, 3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1, 4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

から成る群からの同一または異なる置換基により、場合によっては単置換から四置換されてもよいフェニル、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジル、フェニル-1-エチル、フェニル-2-エチル、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、フェノキシメチルまたはフェニルチオメチル、

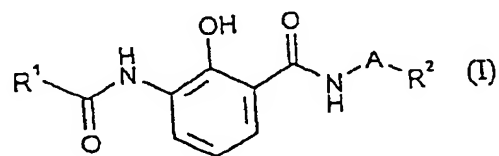
の請求の範囲第2項に記載の式(I)の化合物。

7. 請求の範囲第1項および第13項に記載の少なくとも1つの式(I)および／または式(IVa)の化合物を含んで成ることを特徴とする、有害生物防除剤。

8. 請求の範囲第1項および第13項に記載の少なくとも1つの式(I)および/または式(IVa)の化合物を、有害生物および/またはそれらの環境に作用させることを特徴とする、有害生物の防除法。

9. 請求の範囲第1項ないし第6項および第13項ないし第17項に記載の式(I)および/または式(IVa)の化合物を、増量剤および/または表面活性剤と混合することを特徴とする、有害生物防除剤の調製法。

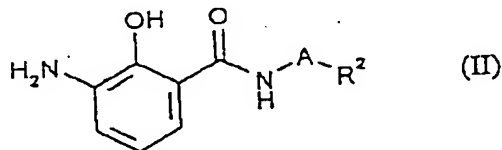
10. 式(I)



式中、

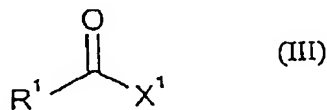
R¹、AおよびR²は請求の範囲第2項に記載の意味を有する、
の化合物の製造法であって、

a) 一般式(II)



式中、

AおよびR²は上記意味を有する、
のアミノサリチルアミドを、一般式(III)

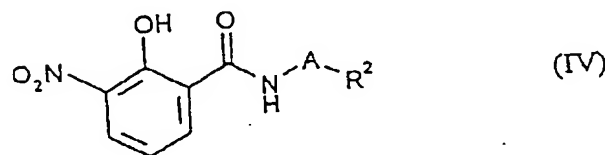


式中、

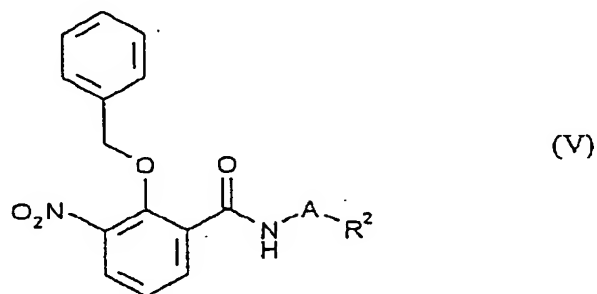
R¹は上記意味を有し、そして

X¹はハロゲン、ヒドロキシル、アルコキシまたはアルキルカルボニルオキシ

を表す、
 のアシル化試薬と、適当ならば希釈剤の存在中で、適当ならば酸受容体の存在中
 で、そして適当ならばさらに反応助剤の存在中で反応させるか、あるいは、
 b) 一般式 (IV)



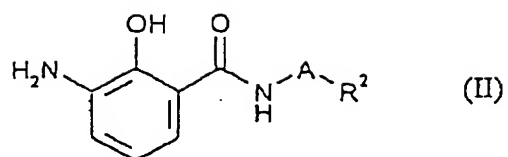
式中、
 AおよびR²は上記意味を有する、
 のニトロサリチルアミドを、ギ酸と、適当ならば触媒の存在下で、そして適当な
 らばさらに反応助剤の存在中で反応させるか、あるいは
 c) 一般式 (V)



式中、
 AおよびR²は上記意味を有する、
 のO-ベンジルニトロサリチルアミドを、ギ酸と、適当ならば水素また

は非貴金属の存在下で、適当ならば触媒の存在中で、そして適当ならばさらに反
 応助剤の存在中で反応させる、
 ことを特徴とする上記製造法。

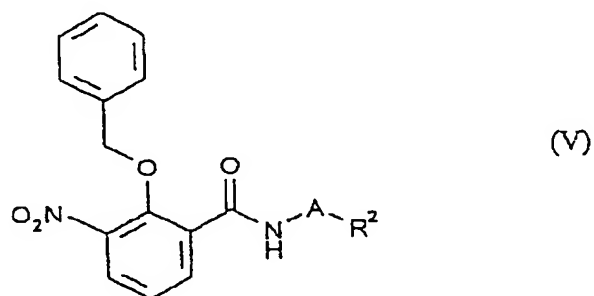
1 1. 式 (II)



式中、

AおよびR²は、請求の範囲第2項に記載の意味を有するが、4-[4-[(3-アミノ-2-ヒドロキシベンゾイル)-アミノ]-3-ヒドロキシ-1-ピペリジル]-N,N,4-トリメチル-2,2-ジフェニル-ブタンアミドは除く、
の化合物。

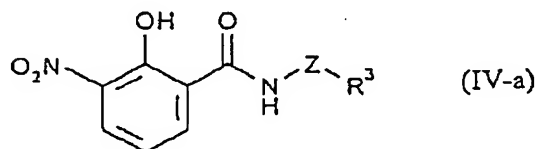
12. 式 (V)



式中、

AおよびR²は、請求の範囲第2項に記載の意味を有する、
の化合物。

13. 式 (IV-a)



式中、

Zは単結合またはアルキレン鎖を表し、そして

R³は各々、場合によっては単一から三置換されてもよいシクロアルキル、シクロアルケニル、アリールまたは最高3個のヘテロ原子を有するヘテロアリール

を表すが、置換基としてニトロ基を除く、
の化合物、そして化合物

N-[3-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズ
アミド、

N-(4-デシルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズアミド、

N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズアミド、

3-ニトロ-N-フェネチル-サリチルアミド、

N-ベンジル-3-ニトロ-サリチルアミド、

N-(4-アミノフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズアミド、

N-(2-クロロ-6-メチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズアミド、

N-(3-クロロ-2-メチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズアミド、

2-ヒドロキシ-3-ニトロ-N-(2,4,6-トリクロロフェニル)-ベンズアミド、

N-(2,3-ジメチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズアミド、

N-(2-エチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズアミド、

2-ヒドロキシ-3-ニトロ-N-フェニル-ベンズアミド、

2-ヒドロキシ-N-(4-メチルフェニル)-3-ニトロベンズアミド、

2-ヒドロキシ-N-(2-メチルフェニル)-3-ニトロベンズアミド、

2-ヒドロキシ-N-(4-メトキシフェニル)-3-ニトロベンズアミド、

2-ヒドロキシ-N-(2-メトキシフェニル)-3-ニトロベンズアミド、

2-ヒドロキシ-N-(2-ヒドロキシフェニル)-3-ニトロベンズアミド、

2-ヒドロキシ-N-(2-ヒドロキシフェニル)-3-ニトロベンズアミド、

2-[(2-ヒドロキシ-3-ニトロベンゾイル)アミノ]-安息香酸、

N-(2,6-ジメチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズアミド、

N-(2,5-ジメチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズアミド、

2-ヒドロキシ-3-ニトロ-N-[2-フェノキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-ベ
ンズアミド、

N-[2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズ
アミド、

2-ヒドロキシ-3-ニトロ-N-[4-(フェニルアゾ)フェニル]-ベンズアミド、
 N-(2,4-ジメチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(5-クロロ-2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(4-クロロ-2-メチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(4-ブromo-2-メチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(4-クロロ-2,5-ジメトキシフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(2,5-ジブromoフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(2-フルオロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(3-フルオロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 2-ヒドロキシ-N-(2-ヨードフェニル)-3-ニトロ-ベンズアミド、

2-ヒドロキシ-N-(3-ヨードフェニル)-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(2-ブromoフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(3-ブromoフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(2,5-ジクロロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(3,4-ジクロロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 2',3',5'-トリクロロ-6'-ヒドロキシ-3-ニトロ-サリチルアニリド、
 N-(p-ヒドロキシ-a-メチルフェネチル)-3-ニトロ-サリチルアミド、
 3-ニトロ-3',5'-ビス(トリフルオロメトキシ)-サリチルアニリド、
 N-(2,4-ジクロロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 2-ヒドロキシ-N-(4-ヨードフェニル)-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(4-ブromoフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(2-クロロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(3-クロロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(4-クロロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、および
 N-(4-フルオロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミドが許容される。
 14. Zが、単結合または1-6個の炭素原子を有するアルキレン鎖を表し、
 R³は、各々が3-12個の炭素原子を有し、そして各々が場合によってはハロゲ

ン、シアノ、カルボキシル、フェニル（これは場合によってはハロゲン、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロゲンアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシまたは C_1-C_4 -ハロゲンアルコキシにより置換されてもよい）、 C_1-C_4 -アルキルまたは C_1-C_4 -アルコキシ-カルボニルから成る群からの同一または異なる置換基により単置

換から三置換されてもよいシクロアルキルまたはシクロアルケニルを表すか、あるいは

3-12個の環の員を有するアリール、または3-8個の環の員を有するヘテロシクリルを表し、これらアリールまたはヘテロシクリルの置換基は、同一または異なる置換基により単置換から三置換されることが可能であり、可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

ハロゲン、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル；

各々が1-6個の炭素原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニルまたはアルキルスルホニル；

各々が2-6個の炭素原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のアルケニルまたはアルケニルオキシ；

各々が1-6個の炭素原子および1-13個の同一または異なるハロゲン原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のハロゲンアルキル、ハロゲンアルコキシ、ハロゲンアルキルチオ、ハロゲンアルキルスルフィニルまたはハロゲンアルキルスルホニル；

各々が2-6個の炭素原子および1-13個の同一または異なるハロゲン原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のハロゲンアルケニルまたはハロゲンアルケニルオキシ；

各々が1-6個の炭素原子を個々のアルキル部分に有し、各々の場合で直鎖または分枝のアシルアミノ、N-アシル-N-アルキルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルカ

ルボニルオキシ、アルコシカルボニル、アルキルスルホニルオキシ、ヒドロキシミノアルキルまたはアルコキシミノアルキル；

各々が1－6個の炭素原子を有し、そして各々が場合によっては、ハロゲンおよび／または1－4個の炭素原子を有する直鎖もしくは分枝アルキルおよび／または1－4個の炭素原子および1－9個の同一もしくは異なるハロゲン原子を有する直鎖もしくは分枝ハロゲノアルキルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のアルキレンまたはジオキシアルキレン；

3－6個の炭素原子を有するシクロアルキル；

ならびに各々が以下の、

ハロゲン、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル；

各々が1－6個の炭素原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニルまたはアルキルスルホニル；

各々が2－6個の炭素原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のアルケニルまたはアルケニルオキシ；

各々が1－6個の炭素原子および1－13個の同一または異なるハロゲン原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のハロゲノアルキルまたはハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルキルチオ、ハロゲノアルキルスルフィニルまたはハロゲノアルキルスルホニル；

各々が2－6個の炭素原子および1－13個の同一または異なるハロゲン原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のハロゲノアルケニ

ルまたはハロゲノアルケニルオキシ；

各々が1－6個の炭素原子を個々のアルキル部分に有し、各々の場合で直鎖または分枝のアシルアミノ、N-アシル-N-アルキルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルコシカルボニル、アルキルスルホニルオキシ、ヒドロキシミノアルキルまたはアルコ

キシミノアルキル；

各々が1-6個の炭素原子を有し、そして各々が場合によっては、ハロゲンおよび／または1-4個の炭素原子を有する直鎖もしくは分枝アルキルおよび／または1-4個の炭素原子および1-9個の同一もしくは異なるハロゲン原子を有する直鎖もしくは分枝ハロゲンアルキルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のアルキレンまたはジオキシアルキレン；または

3-6個の炭素原子を有するシクロアルキル、

から成る群から同一または異なる置換基により、場合によっては単置換または多置換されてもよいアリール、アリールオキシ、アリールチオ、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアルキル、アリールチオアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリルチオ、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルキルオキシまたはヘテロシクリルアルキルチオ、

の請求の範囲第13項に記載の式(IV-a)の化合物。

15. Aが、単結合またはメチレン、1,1-エチレン、1,2-エチレン、1,

1-, 1,2-, 1,3-もしくは2,2-プロピレン、1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-ブチレンまたは1,1-, 1,2-または1,3-(2-メチル-プロピレン)を表し、

R¹が、水素、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-, i-, s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシを表し、

R²は、各々が場合によってはフッ素、塩素、臭素、シアノ、カルボキシル、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロピル、メトキシ-カルボニルまたはエトキシ-カルボニルにより単置換から三置換されてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル、シクロウンデシル、シクロドデシル、テトラリニル、デカリニル、シクロドデカトリエニル、インダニル、ノルボルニルまたはアダマンチルを表すか；あるいは

各々が場合によっては単置換から三置換されてもよいフェニル、ナフチル、ベ

ンジル、フェネチル、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、インドリル、チエニル、ベンゾチエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジル、キノリル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、オキシラニル、オキセタニル、テトラヒドロフリル、ペルヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニルまたはモルホリニルを表し、可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

フッ素、塩素、臭素、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-

もしくはi-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、ヒドロキシミノメチル、ヒドロキシミノエチル、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルまたはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換から四置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、
ならびに／または各々が以下の、

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカル

バモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルまたはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルまたはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、

から成る群からの同一または異なる置換基により、場合によっては単置換から四置換されてもよく、各々が1-4個の炭素原子をそれぞれ

のアルキル鎖中に有するフェニル、フェノキシ、フェニルアルキル、フェニルチオ、フェノキシアルキル、フェニルチオアルキル、フェニルアルキルオキシまたはフェニルアルキルチオ、

の請求の範囲第13項に記載の式(IV-a)の化合物。

16. Aが単結合またはメチレン、1,1-エチレン、1,2-エチレン、1,1-, 1,2-

、1,3-もしくは2,2-プロピレン、1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-ブチレンまたは1,1-, 1,2-もしくは1,3-(2-メチル-プロピレン)を表し、

R¹が、水素、メチル、エチル、メトキシまたはエトキシを表し、

R²は、各々が場合によってはフッ素、塩素、臭素、シアノ、カルボキシル、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロピル、メトキシ-カルボニルまたはエトキシ-カルボニルにより単置換から三置換されてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル、シクロウンデシル、シクロドデシル、テトラリニル、デカリニル、シクロドデカトリエニル、インダニル、ノルボルニルまたはアダマンチルを表すか；あるいは

各々が場合によっては単置換から三置換されてもよいフェニル、ナフチル、ベンジル、フェネチル、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、インドリル、チエニル、ベンゾチエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジル、キノリル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、オキシラニル、オキセタニル、テトラヒドロフリル、ペルヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニルまたはモルホリニルを表し、可

能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-, i-, s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエ

チルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルまたはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換から四置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、

ならびに/または各々が以下の、

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルもしくはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,

3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、ならびに

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキ

シル、

から成る群からの同一または異なる置換基により、場合によっては単置換から四置換されてもよいフェニル、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジル、フェニルエチル、フェニルプロピル、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、フェノキシメチル、フェノキシエチル、フェニルチオメチルまたはフェニルチオエチル、の請求の範囲第13項に記載の式(IV-a)の化合物。

17. Aは単結合またはメチレン、1,1-エチレン、1,2-エチレン、1,1-プロピレン、1,2-プロピレンもしくは2,2-プロピレンを表し、

R¹が、水素を表し、

R³は、各々が場合によってはメチル、エチル、メトキシまたはエトキシにより単置換または二置換されてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル、シクロウンデシル、シクロドデシル、テトラリニル、デカリニル、シクロドデカトリエニル、インダニル、ノルボルニルまたはアダマンチルを表すか、あるいは各々が場合によっては単置換から三置換されてもよいフェニル、ナフチル、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、インドリル、チエニル、ベンゾチエニル、ビリジル、キノリル、ピリミジル、ピリダジニルまたはピラジニルを表し、そして可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロ

ポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメト

キシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルまたはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換から四置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

ならびに/または各々が以下の、

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチル

スルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルもしくはエトキシミノエチル、な

らびに

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよび*n*-もしくは*i*-プロピルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1, 3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1, 4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

から成る群からの同一または異なる置換基により、場合によっては単置換から四置換されてもよいフェニル、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジル、フェニル-1-エチル、フェニル-2-エチル、ベンジロキシ、ベンジルチオ、フェノキシメチルまたはフェニルチオメチル、

の請求の範囲第13項に記載の式(IV-a)の化合物。

18. 有害生物を防除するための、請求の範囲第13項に定義した式(IV-a)の化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

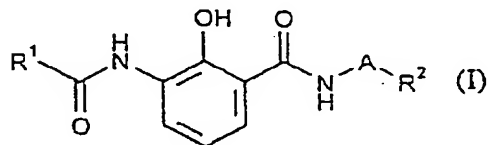
アシルアミノサリチル酸アミド

およびそれらの有害生物防除剤としての使用

本発明は、既知の、および新規のアシルアミノサリチルアミド、それらの複数の製造法、ならびに有害生物防除剤としてのそれらの使用に関する。本出願はさらに、新規中間体、それらの複数の製造法、および有害生物防除剤としてのそれらの使用に関する。

例えば化合物3-ホルムアミド-サリチルアニリドおよび3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-N-(フェニルメチル)-ベンズアミドのようなある種のアシルアミノサリチルアミドは、すでに開示されている(例えば、B. Biochim Biophys. Acta(1993), 1143(3), 262-8, J. Med. Chem. (1990), 33(1), 136-42またはJ. Biol. Chem. (1971), 246(23), 7125-30を比較にされたい)。しかしこれらの従来技術の化合物の有害生物に対する活性は、今日まで記載されなかった。

今回、一般式 (I)



式中、

Aは、単結合またはアルキレン鎖を表し、

R¹は、水素、アルキルまたはアルコキシを表し、

R²は、それぞれ場合によっては置換されてもよいシクロアルキル、シクロアルケニル、アリールまたはヘテロシクリルを表す、
のアシルアミノサリチルアミドが、植物および工業材料上の有害生物、

特にカビ、昆虫および細菌を防除するために適することが見出された。

定義において、アルキル、アルケン、アルケニルまたはアルキニルのような炭化水素鎖は、またアルコキシ、アルキルチオまたはアルキルアミノのようなヘテロ原子と結合している状態にあっても、各々の場合に直鎖または分枝である。

ハロゲンは一一般的に、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素、好ましくはフッ素、塩素または臭素、特にフッ素または塩素を表す。

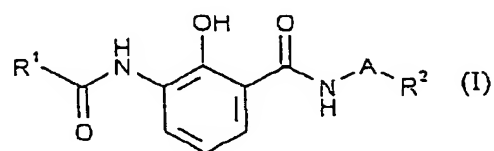
アリールは、例えばフェニル、ナフチル、アントラニル、フェナントリル、のような芳香族の単一または多環式炭化水素環好ましくはフェニルまたはナフチル、特にフェニルを表す。

ヘテロシクリルは、少なくとも1つの環の員がヘテロ原子（すなわち炭素以外の原子）である最高8個の環の員を有する飽和または不飽和の、ならびにまた芳香族および環式化合物を表す。もし環が1個より多くのヘテロ原子を含むならば、それらは同一または異なることができる。ヘテロ原子は、好ましくは酸素、窒素または硫黄である。適当な場合は、環式化合物は、他の炭素環式または複素環式の融合または架橋した環と一緒に多環式環系を形成する。単一または二環式環系が好ましく、特に単一または二環式芳香族環系が好ましい。

シクロアルキルは、飽和炭素環式の環式化合物を表し、これは適当ならば、他の炭素環式の融合または架橋した環と一緒に、多環式環系を形成する。

シクロアルケニルは、少なくとも1つの二重結合を含む炭素環式環を表し、そして適当ならば他の炭素環式の融合または架橋した環と一緒に、多環式環系を形成する。

また本出願は、一般式 (I)



式中、

Aは、単結合または場合によっては置換されてもよいアルキレンを表し、

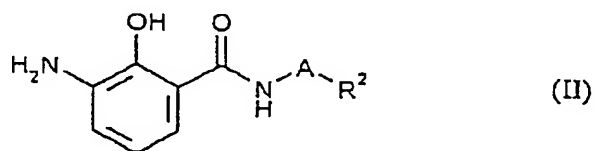
R¹は、水素、アルキルまたはアルコキシを表し、

R²は、それぞれ場合によっては置換されてもよいシクロアルキル、シクロアルケニル、アリールまたはヘテロシクリルを表すが、置換基としてニトロ基は除く、

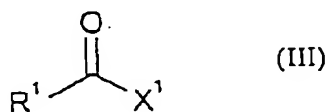
そして化合物 3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-N-{4-[2,4,6-トリス(1-メチルプロピル)フェノキシ]フェニル}-ベンズアミド、N-{4-[3,5-ビス-(1,1-ジメチルエチル)-フェノキシ]-フェニル}-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-ベンズアミド、N-{4-[2,4-ビス-(1,1-ジメチルエチル)-フェノキシ]-フェニル}-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-ベンズアミド、N-{4-[2,6-ビス-(1-メチルプロピル)-フェノキシ]-フェニル}-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-ベンズアミド、3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-N-{4-[3-(トリフルオロメチル)-フェノキシ]フェニル}-ベンズアミド、N-{4-[4-(1,1-ジメチルエチル)-フェノキシ]-フェニル}-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-ベンズアミド、3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-N-(4-フェノキシフェニル)-ベンズアミド、N-(4-プチルフェニル)-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-ベンズアミドおよびN-{3-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル}-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロ

キシ-ベンズアミド、3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-N-(フェニルメチル)-ベンズアミド、3-ホルミルアミド-サリチルアニリドおよび3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-N-(2-フェニルエチル)-ベンズアミドは除外する、
の新規アシルアミノサリチルアミドに関する。

さらに一般式 (I) のアシルアミノサリチルアミドは、
a) 一般式 (II)



式中、
AおよびR²は上記意味を有する、
のアミノサリチルアミドを、一般式 (III)



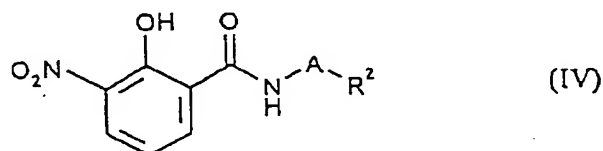
式中、

R^1 は上記意味を有し、そして

X^1 はハロゲン、ヒドロキシル、アルコキシまたはアルキルカルボニルオキシを表す、

のアシル化試薬と、適当ならば希釈剤の存在中で、適当ならば酸受容体の存在中で、そして適当ならばさらに反応助剤の存在中で反応させる時、あるいは、

b) 一般式 (IV)

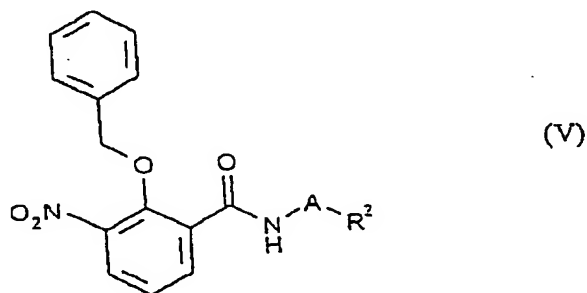


式中、

Aおよび R^2 は上記意味を有する、

のニトロサリチルアミドを、ギ酸と、適当ならば触媒の存在下で、そして適当ならばさらに反応助剤の存在中で反応させる時、あるいは

c) 一般式 (V)



式中、

Aおよび R^2 は上記意味を有する、

のO-ベンジルニトロサリチルアミドを、ギ酸と、適当ならば水素または非貴金属の存在下で、適当ならば触媒の存在中で、そして適当ならばさらに反応助剤の存在中で反応させる時に得られることが見出された。

適当ならば、本発明の化合物は、可能な種々の異性体、特に例えばEおよびZ

、トレオおよびエリトロのような立体異性体、ならびに光学異性体の混合物状態で存在する。EおよびZ異性体、トレオおよびエリトロ、ならびに光学異性体、ならびに任意のこれらの混合物も特許請求する。

好適であるのは式 (I) の化合物の使用、あるいは好適であるのは式 (I) の新規化合物であり、式中、

Aは単結合または1-6個の炭素原子を有するアルキレン鎖を表し、

R¹は水素、各々1-4個の炭素原子を有するアルキルまたはアルコキシを表し、

R²は、各々が3-12個の炭素原子を有し、そして各々が場合によってはハロゲン、シアノ、カルボキシル、フェニル（これは場合によってはハロゲン、シアノ、C₁-C₄-アルキルまたはC₁-C₄-ハロゲンアルキル、C₁-C₄-アルコキシまたはC₁-C₄-ハロゲンアルコキシにより置換されてもよい）、C₁-C₄-アルキルまたはC₁-C₄-アルコキシカルボニルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよいシクロアルキルまたはシクロアルケニルを表すか、あるいは

3-12個の環の員を有するアリール、または3-8個の環の員を有するヘテロシクリルを表し、これらアリールまたはヘテロシクリルは置換基をもつことができ、同一または異なる置換基により単置換または多置換されることができ、可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

ハロゲン、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル；

直鎖または分枝のアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニルまたはアルキルスルホニルの各々の場合、各々が1-6個の炭素原子を有し；

直鎖または分枝のアルケニルまたはアルケニルオキシの各々の場合、

各々が2-6個の炭素原子を有し；

直鎖または分枝のハロゲンアルキル、ハロゲンアルコキシ、ハロゲンアルキルチオ、ハロゲンアルキルスルフィニルまたはハロゲンアルキルスルホニル各々の

場合各々が1-6個の炭素原子および1-13個の同一または異なるハロゲン原子を有し；

直鎖または分枝のハロゲノアルケニルまたはハロゲノアルケニルオキシの各々の場合、各々が2-6個の炭素原子および1-13個の同一または異なるハロゲン原子を有し；

直鎖または分枝のアシルアミノ、N-アシル-N-アルキルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニルオキシ、ヒドロキシミノアルキルまたはアルコキシミノアルキルの各々の場合、各々が1-6個の炭素原子を個々のアルキル部分に有し；

二価のアルキレンまたはジオキシアリレンの各々の場合、各々が1-6個の炭素原子を有し、そして各々が場合によっては、ハロゲンおよび/または1-4個の炭素原子を有する直鎖もしくは分枝アルキルおよび/または1-4個の炭素原子および1-9個の同一もしくは異なるハロゲン原子を有する直鎖もしくは分枝ハロゲノアルキル；

3-6個の炭素原子を有するシクロアルキル；

ならびに各々が以下の、

ハロゲン、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル

から成る群から同一または異なる置換基により、場合により単置換または多置換されてもよい、アリール、アリールオキシ、アリールチオ、

アリールアルキル、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリル、アリールチオアリル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリルチオ、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルキルオキシまたはヘテロシクリルアルキルチオ；から成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよく；

直鎖または分枝のアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニルまたはアルキルスルホニルの各々の場合、各々が1-6個の炭素原子を有し

;

直鎖または分枝のアルケニルまたはアルケニルオキシの各々の場合、各々が2-6個の炭素原子を有し;

直鎖または分枝のハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルキルチオ、ハロゲノアルキルスルフィニルまたはハロゲノアルキルスルホニルの各々の場合、各々が1-6個の炭素原子および1-13個の同一または異なるハロゲン原子を有し、;

直鎖または分枝のハロゲノアルケニルまたはハロゲノアルケニルオキシの各々の場合、各々が2-6個の炭素原子および1-13個の同一または異なるハロゲン原子を有し;

直鎖または分枝のアシルアミノ、N-アシル-N-アルキルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニルオキシ、ヒドロキシミノアルキルまたはアルコキシミノアルキルの各々の場合、各々が1-6個の炭素原子を個々のアルキル部分に有し;

二価のアルキレンまたはジオキシアリレンの各々の場合、各々が1-6個の炭素原子を有し、そして各々が場合によっては、ハロゲンおよび/または1-4個の炭素原子を有する直鎖もしくは分枝アルキルおよび/または1-4個の炭素原子および1-9個の同一もしくは異なるハロゲン原子を有する直鎖もしくは分枝ハロゲノアルキルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよく;あるいは

3-6個の炭素原子を有するシクロアルキル。

特に本発明は、式(I)の化合物の使用、あるいは式(I)の新規化合物に関し、式中、

Aは単結合またはメチレン、1,1-エチレン、1,2-エチレン、1,1-, 1,2-, 1,3-もしくは2,2-プロピレン、1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-ブチレンまたは1,1-, 1,2-もしくは1,3-(2-メチル-プロピレン)を表し、

R¹は、水素、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-, i-, s-もしくはt

-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシを表し；

R²は各々が場合によってはフッ素、塩素、臭素、シアノ、カルボキシル、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロピル、メトキシ-カルボニルまたはエトキシ-カルボニルにより単置換から六置換されてもよい、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル、シクロウンデシル、シクロドデシル、テトラリニル、デカリニル、シクロドデカトリエニル、インダニル、ノルボルニ

ルまたはアダマンチルを表すか；あるいは

各々が場合によっては単置換から三置換されてもよいフェニル、ナフチル、ベンジル、フェネチル、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、インドリル、チエニル、ベンゾチエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジル、キノリル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、オキシラニル、オキセタニル、テトラヒドロフリル、ペルヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニルまたはモルホリニルを表し、可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

フッ素、塩素、臭素、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニ

ルオキシ、エチルスルホニルオキシ、ヒドロキシミノメチル、ヒドロキシミ

ノエチル、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルまたはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換から四置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、
ならびに/または各々が以下の、

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチル

スルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルもしくはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-

ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、ならびに

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、から成る群からの同一または異なる置換基により場合によっては単置換から四置換されてもよく、各々が個々のアルキル鎖に1-4個の炭素原子を有するフェニル、フェノキシ、フェニルアルキル、フェニルチオ、フェノキシアルキル、フェニルチオアルキル、フェニルアルキルオキシまたはフェニルアルキルチオ。

特に好適であるのは、式(1)の化合物の使用、あるいは式(1)の新規化合物であり、式中、

Aは単結合またはメチレン、1,1-エチレン、1,2-エチレン、1,1-, 1,2-, 1,3-もしくは2,2-プロピレン、1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-ブチレンまたは1,1-, 1,2-もしくは1,3-(2-メチル-プロピレン)を表し、

R¹は、水素、メチル、エチル、メトキシまたはエトキシを表し、

R²は各々が場合によってはフッ素、塩素、臭素、シアノ、カルボキシル、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロピル

、メトキシカルボニルまたはエトキシカルボニルにより単置換から六置換されてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル、シクロウンデシル、シクロドデシル、テトラリニル、デカリニル、シクロドデカトリエニル、インダニル、ノルボルニルまたはアダマンチルを表すか、あるいは

各々の場合で場合によっては単置換から三置換されてもよいフェニル、ナフチル、ベンジル、フェネチル、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、インドリル、チエニル、ベンゾチエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジル、キノリル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、オキシラニル、オキセタニル、テトラヒドロフリル、ペルヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニルまたはモルホリニルを表し、可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、

メチル、エチル、n-もしくは i-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-

ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルまたはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換から四置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、

ならびに/または各々が以下の、

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチル

スルホニル、アセチルアミノ、

ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルもしくはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、ならびに

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、

から成る群からの同一または異なる置換基により、場合によっては単置換から四置換されてもよいフェニル、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジル、フェニルエチル、フェニルプロピル、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、フェノキシメチル、フェノキシエチル、フェニルチオメチルまたはフェニルチオエチル。

特に大変好適であるのは、式(I)の化合物の使用、あるいは式(I)の新規化合物であり、式中、

Aは単結合またはメチレン、1,1-エチレン、1,2-エチレン、1,1,-プロピレン、1,2-プロピレンまたは2,2-プロピレンを表し、

R¹は水素を表し；

R²は各々が場合によってはメチル、エチル、メトキシまたはエトキシにより単置換または二置換されてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル、シクロウンデシル、シクロドデシル、テトラリニル、デカリニル、シクロドデカトリエニル、インダニル、ノルボルニルまたはアダマンチルを表すか、あるいは

各々の場合で場合によっては単置換から三置換されてもよいフェニル、ナフチル、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、インドリル、チエニル、ベンゾチエニル、ピリジル、キノリル、ピリミジル、ピリダジニルまたはピラジニルを表し、そして可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n*-もしくは*i*-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、*N*-ホルミル-*N*-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、*n*-もしくは*i*-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エ

トキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルまたはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよび*n*-もしくは*i*-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換から四置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

ならびに／または各々が以下の、

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n*-もしくは

はi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、

メトキシミノエチルもしくはエトキシミノエチル、ならびに

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1, 3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1, 4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

から成る群からの同一または異なる置換基により、場合によっては単置換から四置換されてもよいフェニル、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジル、フェニル-1-エチル、フェニル-2-エチル、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、フェノキシメチルまたはフェニルチオメチル。

一般的または好適範囲で与えられた上記の基の定義は、式(I)の化合物の最終生成物に、そして同様に各々の場合で製造に必要な出発物質または中間体にも適用する。

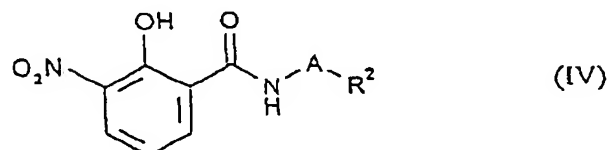
これらの基の定義は、互いに所望するように組み合わせることができ、すなわち好適化合物の与えられた範囲間での組み合わせも可能である。

式(II)は、方法a)を行うために出発物質として必要なアミノサリチルアミドの一般的定義を提供する。式(II)において、AおよびR²は好ましくは、または特に、本発明の式(I)の化合物の記載に関連して、AおよびR²について

好適または特に好適であると述べた意味を有する。

4-(4-[(3-アミノ-2-ヒドロキシベンゾイル)-アミノ]-3-ヒドロキシ-1-ピペリジル)-N,N,4-トリメチル-2,2-ジフェニルブタンアミドを除き、式(II)の出発物質は新規であり、そしてこれらも本出願の一部である。

式(II)のアミノサリチルアミドは、一般式(IV)

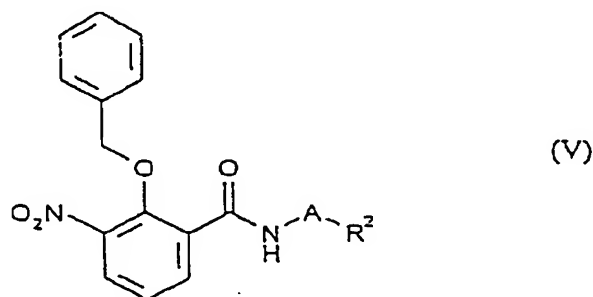


式中、

AおよびR²は上記意味を有する、

のニトロサリチルアミドを、水素と、適当であれば希釈剤（好ましくは酢酸メチルまたは酢酸エチルのようなエステル；メタノール、エタノール、n-もしくはi-プロパノール、n-、i-、sec-もしくはtert-ブタノール、エタンジオール、プロパン-1,2-ジオール、エトキシエタノール、メトキシエタノール、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテルのようなアルコール；水、例えば塩化アンモニウム溶液のような塩溶液、例えば塩酸または酢酸のような酸、ならびに上記希釈剤の任意の組み合わせ）が存在する中で、そして適当であれば活性炭のような支持体材料上で、例えばラニーニッケル、パラジウムまたは白金のような、適当であれば触媒の存在下で反応させる時（方法a-1a）、

あるいは一般式(V)



式中、

AおよびR²は上記意味を有する、

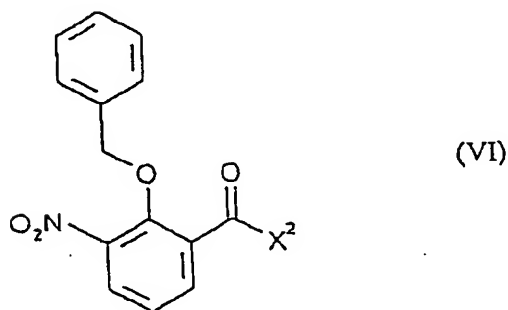
の0-ベンジル-ニトロサリチルアミドを、水素と、適当であれば希釈剤（好ましくは酢酸メチルまたは酢酸エチルのようなエステル；メタノール、エタノール、n-もしくはi-プロパノール、n-、i-、sec-もしくはtert-ブタノール、エタノール、プロパン-1,2-ジオール、エトキシエタノール、メトキシエタノール、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテルのようなアルコール；例えば酢酸のような酸；水、ならびに上記希釈剤の任意の組み合わせ）が存在する中で、そして適当であれば活性炭のような支持体材料上の、例えばラニーニッケル、パラジウムまたは白金のような、適当であれば触媒の存在下で反応させる時（方法a-1b）に得られる。

本発明の方法a-1a)を行うために出発物質として必要な式(IV)のニトロサリチルアミドは、本発明の方法b)の記載と関連して以下にさらに記載する。

式(V)は、本発明の方法a-1b)を行うために出発物質として必要な0-ベンジル-ニトロサリチルアミドの一般的定義を提供する。式(V)において、AおよびR²は好ましくは、そして特に、本発明の式(I)の化合物の記載に関連して、AおよびR²について好適または特に好適であると述べた意味を有する。

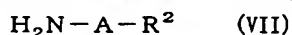
式(V)の0-ベンジル-ニトロサリチルアミドは、これまで知られておらず、そして新規物質であり、本出願の一部を構成する。

式(V)の0-ベンジル-ニトロサリチルアミドは、一般式(VI)



式中、

X^2 はハロゲン、ヒドロキシルまたはアルコキシを表す、
の0-ベンジル-ニトロサリチル酸誘導体を、式 (VII)



式中、

Aおよび R^2 は上記意味を有する、

のアミンと、適当であれば希釈剤（好ましくは例えば、石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはデカリンのような脂肪族、脂環式または芳香族炭化水素；例えばクロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、テトラクロロメタン、ジクロロエタンまたはトリクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル t -ブチルエーテル、メチル t -アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタンまたはアニソールのようなエーテル；アセトン、ブタノン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノンのようなケトン；アセトニトリル、プロピオニトリル、 n -もしくは i -ブチロニトリルまたはベンゾニトリルのようなニトリル； N,N -ジメチルホルムアミド、 N,N -

ジメチルアセトアミド、 N -メチルホルムアニリド、 N -メチルピロリドンまたはヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド；酢酸メチルまたは酢酸エチルのようなエステル；ジメチルスルフォキシドのようなスルフォキシド；あるいはスルホランのようなスルホン）が存在する中で、適当であれば縮合剤（例えば、ホスゲン、リン酸トリプロミド、リン酸トリクロライド、リン酸ペンタクロライド、リン酸オキシクロライドまたは塩化チオニルのような酸ハリド形成剤；エチルクロロホルメート、メチルクロロホルメート、イソプロピルクロロホルメート、イソブチルクロロホルメートまたはメタンスルホニルクロライドのような無水物形成剤； N,N' -ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)のようなカルボジイミド、あるいはリン酸ペントキシド、ポリリン酸、 N,N' -カルボニルジイミダゾール、2-エトキシ- N -エトキシカルボニル-1,2-ジヒドロキノリン(EEDQ)またはトリフェニルホスフィン／四塩化炭素のような他の通常の縮合剤)の存在下で、適当であれ

ば酸受容体(好ましくはアルカリ金属土類水素化物、水酸化物、アミド、アルコール、酢酸塩、炭酸塩もしくは炭酸水素塩、またはアルカリ金属水素化物、水酸化物、アミド、アルコール、酢酸塩、炭酸塩もしくは炭酸水素塩、例えば水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチレート、ナトリウムエチレート、カリウムtert-ブチレート、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化アンモニウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム、酢酸アンモニウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウムまたは炭酸アンモニウム、あるいはトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジメチルベンジルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N-メチ

ルモルホリン、N,N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビスクロオクタン(DABCO)、ジアザビスクロノネン(DBN)またはジアザビスクロウンデセン(DBU)のような第三アミン)の存在下で反応させる時に得られる(方法a-2)。

式(VI)は、本発明の方法a-2)を行うために出発物質として必要なO-ベンジル-ニトロサリチル酸誘導体の一般的定義を提供する。式(VI)において、 X^2 はハロゲン、好ましくは塩素、ヒドロキシルまたはアルコキシ、好ましくはメトキシまたはエトキシを表す。

式(VI)のO-ベンジル-ニトロサリチル酸誘導体は、周知であり、そして周知方法(例えば、J. Am. Chem. Soc. 1959, 5215-5217を比較されたい)により製造できる。

式(VII)は、本発明の方法a-2)を行うために出発物質としてさらに必要なアミンの一般的定義を提供する。式(VII)において、Aおよび R^2 は好ましくは、または特に、本発明の式(I)の化合物の記載に関連して、Aおよび R^2 について好適または特に好適であると述べた意味を有する。

式(VII)のアミンは、有機化学において周知の試薬である。

式(III)は、本発明の方法a)を行うために出発物質としてさらに必要なアシル化試薬の一般的定義を提供する。式(III)において、 R^1 は好ましくは、または特に、本発明の式(I)の化合物の記載に関連して、 R^1 について好適または

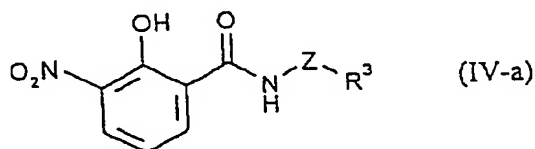
は特に好適であると述べた意味を有する。 X^1 はハロゲン、ヒドロキシル、アルコキシまたはアルキルカルボニルオキシ、好ましくは塩素、ヒドロキシル、メトキシ、エトキシまたはアセトキシを表す。

一般式 (III) のアシル化試薬は、有機化学において周知の試薬である。

式 (IV) は、本発明の方法 b) を行うために出発物質として必要なニトロサリチルアミドの一般的定義を提供する。式 (IV) において、A および R^2 は好ましくは、そして特に、本発明の式 (I) の化合物の記載に関連して、A および R^2 について好適または特に好適であると述べた意味を有する。

式 (IV) のニトロサリチルアミドは、幾つかの場合では周知であり、そして/または周知方法(例えば、Arzneim-Forsch(1978), 28(9), 1550-3を比較されたい)により製造できる。

新規であり、そして本発明の一部でもあるのは、式 (IV-a)



式中、

Z は単結合またはアルキレン鎖を表し、そして

R^3 は各々の場合で単一から三置換されてもよいシクロアルキル、シクロアルケニル、アリールまたは最高 3 個のヘテロ原子を有するヘテロアリールを表すが、置換基としてニトロ基を除く、

のニトロサリチルアミドであり、そして化合物

N-[3-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズアミド、

N-(4-デシルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズアミド、

N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロベンズアミド、
3-ニトロ-N-フェネチルサリチルアミド、

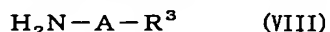
N-ベンジル-3-ニトロ-サリチルアミド、
N-(4-アミノフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
N-(2-クロロ-6-メチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
N-(3-クロロ-2-メチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
2-ヒドロキシ-3-ニトロ-N-(2,4,6-トリクロロフェニル)-ベンズアミド、
N-(2,3-ジメチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
N-(2-エチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
2-ヒドロキシ-3-ニトロ-N-フェニル-ベンズアミド、
2-ヒドロキシ-N-(4-メチルフェニル)-3-ニトロ-ベンズアミド、
2-ヒドロキシ-N-(2-メチルフェニル)-3-ニトロ-ベンズアミド、
2-ヒドロキシ-N-(4-メトキシフェニル)-3-ニトロ-ベンズアミド、
2-ヒドロキシ-N-(2-メトキシフェニル)-3-ニトロ-ベンズアミド、
2-ヒドロキシ-N-(2-ヒドロキシフェニル)-3-ニトロ-ベンズアミド、
2-ヒドロキシ-N-(2-ヒドロキシフェニル)-3-ニトロ-ベンズアミド、
2-[(2-ヒドロキシ-3-ニトロベンゾイル)アミノ]-安息香酸、
N-(2,6-ジメチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
N-(2,5-ジメチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
2-ヒドロキシ-3-ニトロ-N-[2-フェノキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-ベンズアミド、
N-[2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
2-ヒドロキシ-3-ニトロ-N-[4-(フェニルアゾ)フェニル]-ベンズアミド、

N-(2,4-ジメチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
N-(5-クロロ-2-メトキシフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
N-(4-クロロ-2-メチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
N-(4-ブロモ-2-メチルフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
N-(4-クロロ-2,5-ジメトキシフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、

N-(2,5-ジブロモフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(2-フルオロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(3-フルオロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 2-ヒドロキシ-N-(2-ヨードフェニル)-3-ニトロ-ベンズアミド、
 2-ヒドロキシ-N-(3-ヨードフェニル)-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(2-ブロモフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(3-ブロモフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(2,5-ジクロロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(3,4-ジクロロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 2',3',5'-トリクロロ-6'-ヒドロキシ-3-ニトロ-サリチルアニリド、
 N-(p-ヒドロキシ-a-メチルフェネチル)-3-ニトロ-サリチルアミド、
 3-ニトロ-3',5'-ビス(トリフルオロメトキシ)-サリチルアニリド、
 N-(2,4-ジクロロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 2-ヒドロキシ-N-(4-ヨードフェニル)-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(4-ブロモフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(2-クロロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、

N-(3-クロロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、
 N-(4-クロロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミド、およびN-(4-フル
 オロフェニル)-2-ヒドロキシ-3-ニトロ-ベンズアミドが許容される。

式 (IV-a) のニトロサリチルアミドは、2-ヒドロキシ-3-ニトロ安息香酸ま
 たは2-ヒドロキシ-3-ニトロベンゾイルクロライドを、式 (VIII)



式中、

AおよびR³は上記意味を有する、

のアミンと、適当であれば希釈剤（好ましくは例えば、石油エーテル、ヘキサン、
 ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キ
 シレンまたはデカリンのような脂肪族、脂環式または芳香族炭化水素；例えばク
 ロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、テトラクロ

ロメタン、ジクロロエタンまたはトリクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル t -ブチルエーテル、メチル t -アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタンまたはアニソールのようなエーテル；アセトン、ブタノン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノンのようなケトン；アセトニトリル、プロピオニトリル、 n -もしくは i -ブチロニトリルまたはベンゾニトリルのようなニトリル； N,N -ジメチルホルムアミド、 N,N -ジメチルアセトアミド、 N -メチルホルムアニド、 N -メチルピロリドンまたはヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド；酢酸メチルまたは酢酸エチルのようなエステル；ジメチルスルフォキシドのようなスル

フォキシド；あるいはスルホランのようなスルホン）が存在する中で、適当であれば縮合剤（例えば、ホスゲン、リン酸トリプロミド、リン酸トリクロライド、リン酸ペンタクロライド、リン酸オキシクロライドまたは塩化チオニルのような酸ハリド形成剤；エチルクロロホルメート、メチルクロロホルメート、プロピルクロロホルメート、イソブチルクロロホルメートまたはメタンスルホニルクロライドのような無水物形成剤； N,N' -ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)のようなカルボジイミド、あるいはリン酸ペントキシド、ポリリン酸、 N,N' -カルボニルジイミダゾール、2-エトキシ- N -エトキシカルボニル-1,2-ジヒドロキノリン(EDQ)またはトリフェニルホスフィン／四塩化炭素のような他の通常の縮合剤)の存在下で、そして適当であれば酸受容体(好ましくはアルカリ土類金属またはアルカリ金属の水素化物、水酸化物、アミド、アルコール、酢酸塩、炭酸塩または炭酸水素塩、例えば水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、カリウム t tert-ブチラート、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化アンモニウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム、酢酸アンモニウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウムまたは炭酸アンモニウム、あるいはトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、 N,N -ジメチルアニリン、 N,N -ジメチルベンジルアミン、ピリジン、 N -メチルピペリジン、 N -メチルモルホリン、 N,N -ジメ

チルアミノピリジン、ジアザビスクロオクタン(DABCO)、ジアザビスクロノネン(DBN)またはジアザビスクロウンデセン(DBU)のような第三アミン)の存在下で反応させる時に得られる(方法b-1)。

さらに、式(IV-a)の新規ニトロサリチルアミドは、植物および工

業材料上の有害生物、好ましくはカビ、昆虫および細菌を防除するために適する。

式(IV-a)は、新規ニトロサリチルアミドの一般的定義を提供する。好適な式(IV-a)の新規化合物は、式中、

Zは、単結合または1-6個の炭素原子を有するアルキレン鎖を表し、
R³は、各々が3-12個の炭素原子を有し、そして各々が場合によってはハロゲン、シアノ、カルボキシル、フェニル(これは場合によってはハロゲン、シアノ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロゲンアルキル、C₁-C₄-アルコキシまたはC₁-C₄-ハロゲンアルコキシにより置換されてもよい)、C₁-C₄-アルキルまたはC₁-C₄-アルコキシ-カルボニルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換から三置換されてもよいシクロアルキルまたはシクロアルケニルを表すか、あるいは

3-12個の環の員を有するアリール、または3-8個の環の員を有するヘテロシクリルを表し、これらアリールまたはヘテロシクリルの置換基は、同一または異なる置換基により単置換から三置換されることが可能であり、可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

ハロゲン、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル；

各々が1-6個の炭素原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニルまたはアルキルスルホニル；

各々が2-6個の炭素原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のア

ルケニルまたはアルケニルオキシ；

各々が1-6個の炭素原子および1-13個の同一または異なるハロゲン原子を

有し、各々の場合で直鎖または分枝のハロゲンアルキル、ハロゲンアルコキシ、ハロゲンアルキルチオ、ハロゲンアルキルスルフィニルまたはハロゲンアルキルスルホニル；

各々が2－6個の炭素原子および1－13個の同一または異なるハロゲン原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のハロゲンアルケニルまたはハロゲンアルケニルオキシ；

各々が1－6個の炭素原子を個々のアルキル部分に有し、各々の場合で直鎖または分枝のアシルアミノ、N-アシル-N-アルキルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニルオキシ、ヒドロキシミノアルキルまたはアルコキシミノアルキル；

各々が1－6個の炭素原子を有し、そして各々が場合によっては、ハロゲンおよび／または1－4個の炭素原子を有する直鎖もしくは分枝アルキルおよび／または1－4個の炭素原子および1－9個の同一もしくは異なるハロゲン原子を有する直鎖もしくは分枝ハロゲンアルキルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のアルキレンまたはジオキシアルキレン；

3－6個の炭素原子を有するシクロアルキル；

ならびに各々が以下の、

ハロゲン、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル；

各々が1－6個の炭素原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニルまたはアルキルスルホニル；

各々が2－6個の炭素原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のアルケニルまたはアルケニルオキシ；

各々が1－6個の炭素原子および1－13個の同一または異なるハロゲン原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のハロゲンアルキルまたはハロゲンアルコ

キシ、ハロゲンアルキルチオ、ハロゲンアルキルスルフィニルまたはハロゲンアルキルスルホニル；

各々が2-6個の炭素原子および1-13個の同一または異なるハロゲン原子を有し、各々の場合で直鎖または分枝のハロゲンアルケニルまたはハロゲンアルケニルオキシ；

各々が1-6個の炭素原子を個々のアルキル部分に有し、各々の場合で直鎖または分枝のアシルアミノ、N-アシル-N-アルキルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニルオキシ、ヒドロキシミノアルキルまたはアルコキシミノアルキル；

各々が1-6個の炭素原子を有し、そして各々が場合によっては、ハロゲンおよび/または1-4個の炭素原子を有する直鎖もしくは分枝アルキルおよび/または1-4個の炭素原子および1-9個の同一もしくは異なるハロゲン原子を有する直鎖もしくは分枝ハロゲンアルキルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のアルキレンまたは

ジオキシアルキレン；または

3-6個の炭素原子を有するシクロアルキル、

から成る群から同一または異なる置換基により、場合によっては単置換または多置換されてもよいアリール、アリールオキシ、アリールチオ、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアルキル、アリールチオアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリルチオ、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルキルオキシまたはヘテロシクリルアルキルチオ、
の化合物である。

特に、本発明は式(IV-a)の新規ニトロサリチルアミドに関し、式中、

Aは、単結合またはメチレン、1,1-エチレン、1,2-エチレン、1,1-, 1,2-, 1,3-もしくは2,2-プロピレン、1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-ブチレンまた

は1,1-, 1,2-または1,3-(2-メチルプロピレン)を表し、

R¹は、水素、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-, i-, s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシを表し、

R²は、各々が場合によってはフッ素、塩素、臭素、シアノ、カルボキシル、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロピル、メトキシカルボニルまたはエトキシカルボニルにより単置換から三置換されてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニ

ル、シクロデシル、シクロウンデシル、シクロドデシル、テトラリニル、デカリニル、シクロドデカトリエニル、インダニル、ノルボルニルまたはアダマンチルを表すか；あるいは

各々が場合によっては単置換から三置換されてもよいフェニル、ナフチル、ベンジル、フェネチル、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、インドリル、チエニル、ベンゾチエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジル、キノリル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、オキシラニル、オキセタニル、テトラヒドロフリル、ペルヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニルまたはモルホリニルを表し、可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

フッ素、塩素、臭素、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-, i-, s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ；n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-

-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ

、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、ヒドロキシミノメチル、ヒドロキシミノエチル、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルまたはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換から四置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、
ならびに/または各々が以下の、

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルまたはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチ

ルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルもしくはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、

から成る群からの同一または異なる置換基により、場合によっては単置換から四置換されてもよく、各々が1-4個の炭素原子をそれぞれのアルキル鎖中に有するフェニル、フェノキシ、フェニルアルキル、フェニルチオ、フェノキシアルキル、フェニルチオアルキル、フェニルアルキルオキシまたはフェニルアルキルチオ。

特に好適であるのは、は式(IV-a)の新規ニトロサリチルアミドであり、式中、

Aは単結合またはメチレン、1,1-エチレン、1,2-エチレン、1,1-, 1,2-, 1,3-もしくは2,2-プロピレン、1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-ブチレンまたは1,1-, 1,2-もしくは1,3-(2-メチル-プロピレン)を表し、

R¹は、水素、メチル、エチル、メトキシまたはエトキシを表し；

R³は、各々が場合によってはフッ素、塩素、臭素、シアノ、カルボ

キシル、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロピル、メトキシ-カルボニルまたはエトキシ-カルボニルにより単置換から三置換されてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル、シクロウンデシル、シクロドデシル、テトラリニル、デカリニル、シクロドデカトリエニル、インダニル、ノルボルニルまたはアダマンチルを表すか；あるいは

各々が場合によっては単置換から三置換されてもよいフェニル、ナフチル、ベンジル、フェネチル、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、インドリル、チエニル、ベンゾチエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ビリジル、キノリル、ピリミジル、

ピリダジニル、ピラジニル、オキシラニル、オキセタニル、テトラヒドロフリル、ペルヒドロピラニル、ピロリジニル、ピペリジニルまたはモルホリニルを表し、可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n*-もしくは*i*-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフ

ルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、*N*-ホルミル-*N*-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、*n*-もしくは*i*-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルまたはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよび*n*-もしくは*i*-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換から四置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、
ならびに／または各々が以下の、

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n*-もしくは*i*-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニ

ルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフ

イニルまたはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジェチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルもしくはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、ならびに

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、

から成る群からの同一または異なる置換基により、場合によっては単置換から四置換されてもよいフェニル、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジル、フェニルエチル、フェニルプロピル、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、フェノキシメチル、フェノキシエチル、フェニルチオメチルまたはフェニルチオエチル。

特に大変好適であるのは、式(IV-a)の新規ニトロサリチルアミドであり、式中、

Aは単結合またはメチレン、1,1-エチレン、1,2-エチレン、1,1-プロピレン、1,2-プロピレンもしくは2,2-プロピレンを表し、

R^1 は、水素を表し；

R^3 は各々が場合によってはメチル、エチル、メトキシまたはエトキシにより単置換または二置換されてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチ

ル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル、シクロウンデシル、シクロドデシル、テトラリニル、デカリニル、シクロドデカトリエニル、インダニル、ノルボルニルまたはアダマンチルを表すか、あるいは

各々が場合によっては単置換から三置換されてもよいフェニル、ナフチル、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、インドリル、チエニル、ベンゾチエニル、ピリジル、キノリル、ピリミジル、ピリダジニルまたはピラジニルを表し、そして可能な置換基は好ましくは以下に列挙するものから選択される：

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n*-もしくは*i*-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、*N*-ホルミル-*N*-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、*n*-もしくは*i*-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ

、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルまたはエトキシミノエチル、

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよび*n*-もしくは*i*-プロピルから成る群から同一または異なる置換基により単置換から四置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

ならびに/または各々が以下の、

フッ素、塩素、臭素、シアノ、ホルミル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルもしくはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルもしくはトリフルオロメチルスルホニル、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、N-ホルミル-N-メチルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチ

ルスルホニルオキシ、メトキシミノメチル、エトキシミノメチル、メトキシミノエチルもしくはエトキシミノエチル、ならびに

各々が場合によってはフッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、エチルおよびn-もしくはi-プロピルから成る群からの同一または異なる置換基により単置換または多置換されてもよい、各々の場合で二価のトリメチレン(プロパン-1,3-ジイル)、テトラメチレン(ブタン-1,4-ジイル)、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、

から成る群からの同一または異なる置換基により、場合によっては単置換から四置換されてもよいフェニル、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジル、フェニル-1-エチル、フェニル-2-エチル、ベンジロキシ、ベンジルチオ、フェノキシメチルまたはフェニルチオメチル。

方法b-1)を行うために出発物質として必要な2-ヒドロキシ-3-ニトロ安息香酸または2-ヒドロキシ-3-ニトロベンゾイルクロライドは、周知である(例えば、J. Chem. Soc., 1953 2049, 2050または米国特許第03527865号明細書を比較されたい)。

式(VIII)は、本発明の方法b-1)を行うために、出発物質としてさらに必

要なアミンの一般的定義を提供する。式 (VIII) において、A および R^3 は好ましくは、または特に、本発明の式 (IV-a) の化合物と関連して、A および R^3 について好適または特に好適であると、さらに上記で記載した意味を有する。

式 (VIII) のアミンは、有機化学で周知な試薬である。

本発明の方法 c) を行うために出発物質として必要な式 (V) の O-ベンジルニトロサリチルアミドは、本発明の方法 a-1 b) の記載に関連してさらに上記に記載されている。

本発明の方法 a) を行うために適当な希釈剤は、すべての不活性な有機溶媒である。これらには好ましくは、例えば石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはデカリンのような脂肪族、脂環式または芳香族炭化水素；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、テトラクロロメタン、ジクロロエタンまたはトリクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルt-ブチルエーテル、メチルt-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタンまたはアニソールのようなエーテル；アセトン、ブタノン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノンのようなケトン；アセトニトリル、プロピオニトリル、n-もしくはi-ブチロニトリルまたはベンゾニトリルのようなニトリル；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチルホルムアニド、N-メチルピロリドンまたはヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド；酢酸メチルまたは酢酸エチルのようなエステル；ジメチルスルフォキシドのようなスルフォキシド、またはスルホランのようなスルホンを含む。

適当であれば、本発明の方法 a) は適切な酸受容体の存在下で行われる。適当な酸受容体は、すべての通例の無機または有機塩基である。これらは好ましくは、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウムまたは炭酸水素ナトリウムのようなアルカリ土類金属水酸化物、酢酸塩、炭酸塩または炭酸水素塩およびアルカリ金属水酸化物、酢酸塩、炭酸塩または炭酸水素塩、ならび

にトリメチルアミ

ン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジメチルベンジルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N-メチルモルホリン、N,N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビスクロオクタン(DABCO)、ジアザビスクロネン(DBN)またはジアザビスクロウンデセン(DBU)のような第三アミンを含む。

適当であれば、本発明の方法b)およびc)は、触媒の存在下で行われる。適当な触媒は、水素化反応に一般的に使用されるすべての触媒である。以下を例として挙げることができる；適当であれば例えば活性炭に担持されているラニーニッケル、パラジウムまたは白金。

適当であれば、本発明の方法c)は水素の存在下でも行われ、あるいは適当であれば非貴金属の存在下で行われる。挙げることができる非貴金属の例は；亜鉛、錫、鉄、アルミニウムまたはマグネシウムである。

本発明の方法a)、b)およびc)を行うための他の反応助剤は、すべての脱水剤、特に無水酢酸である。

本発明の方法a)、b)およびc)を行う時、反応温度は実質的範囲内で変動できる。一般的に反応は、0℃-180℃、好ましくは0℃-130℃の温度で行われる。

式(I)の化合物を製造するために、本発明の方法a)を行うためには、1モルの式(II)のアミノサリチルアミドあたり一般的に1-2000モル、好ましくは1-800モルの式(III)のアシル化剤が使用される。

式(I)の化合物を製造するために、本発明の方法b)およびc)を行うためには、それぞれ1モルの式(IV)のニトロサリチルアミドまたは式(V)0-ベンジルニトロサリチルアミドあたり、一般的に100-2000モル、好ましくは200-1000モルのギ酸が使用される。

本発明の方法a)、b)およびc)は、一般的に大気圧下で行われる。しかし、これらの反応を、一般的に0.1から10バールの間の加圧または減圧下で行うこともできる。

本発明の活性化合物は、強力な殺微生物活性を有し、そして望ましくない微生物を防除するような実際の条件下で使用できる。この活性化合物は、作物保護生成物、特に殺菌・殺カビ剤としての使用に適する。

殺菌・殺カビ剤は、ネコブカビ綱、卵菌綱、ツボカビ綱、接合類、子囊菌類、担子菌類および不完全菌類を防除するための作物保護に使用される。

殺バクテリア剤は、シュードモナス科、リゾビウム科、腸内細菌科、コリネバクテリア (*Corynebacteriaceae*) 科およびストレプトマイセス (*Streptomyetaceae*) 科を防除するための作物保護に使用される。

真菌・カビおよび細菌性疾患を引き起こす、上記に掲げた属名に入る幾つかの病原菌は、限定するわけではないが、以下に例として挙げることができる：

例えばイネ白葉枯菌病菌のようなカントモナス (*Xanthomonas*) 種；

例えば斑点細菌病菌のようなシュードモナス (*Pseudomonas*) 種；

例えばエリヴニア アミロボーラ (*Erwinia amylovora*) のようなエリヴニア (*Erwinia*) 種；

例えばピチウム ウルチウム (*Pythium ultimum*) のようなピチウム (*Pythium*) 種；

例えばフィトファソーラ インフェスタンス (*Phytophthora infestans*) のようなフィトファソーラ (*Phytophthora*) 種；

例えばシュードペロノスポーラ ヒュームリ (*Pseudoperonospora humu*

li) またはシュードペロノスポーラ キュベシス (*Pseudoperonospora cubensis*) のようなシュードペロノスポーラ (*Pseudoperonospora*) 種；

例えばプラスモパラ ビチコーラ (*Plasmopara viticola*) のようなプラスモパラ (*Plasmopara*) 種；

例えばブレミア ラクタカエ (*Bremia lactucae*) のようなブレミア (*Bremia*) 種；

例えばペロノスポーラ ピシ (*Peronospora pisi*) またはピー. ブラッシカエ (*P. b. brassicae*) のようなペロノスポーラ (*Peronospora*) 種；

例えばエリシフェ グラミニス (*Erysiphe graminis*) のようなエリシフェ (*Erysiphe*) 種；

例えばセファエロセカ フリギネア (*Sphaerotheca fuliginea*) のようなセファエロセカ (*Sphaerotheca*) 種 ;

例えばポドスファエラ ロイコトリカ (*Podosphaera leucotricha*) のようなポドスファエラ (*Podosphaera*) 種 ;

例えばベンチュリア イナエキユリアス (*Venturia inaequalis*) のようなベンチュリア (*Venturia*) 種 ;

例えばピレノフォーラ テレス (*Pyrenophora teres*) またはビー. グラミネア (*P. graminea*) (分生子形: ドレクスレラ、異名: ヘルミトスポリウム) のようなピレノフォーラ (*Pyrenophora*) 種 ;

例えばコクリオボーラス サチイパス (*Cochliobolus sativus*) (分生子形: ドレクスレラ、異名: ヘルミトスポリウム) のようなコクリオボーラス (*Cochliobolus*) 種 ;

例えばウロマイセス アッペンディキュラタス (*Uromyces appendiculatus*) のようなウロマイセス (*Uromyces*) 種 ;

例えばブッシニア レコンディタ (*Puccinia recondita*) のようなブッシニア (*Puccinia*) 種 ;

例えばスクレオチニア スクレロチロウム (*Sclerotinia sclerotiorum*) のようなスクレオチニア (*Sclerotinia*) 種 ;

例えばチレチア カリーズ (*Tilletia caries*) のようなチレチア (*Tilletia*) 種 ;

例えばウスチラゴ ヌダ (*Ustilago nuda*) またはウスチラゴ アベナエ (*Ustilago avenae*) のようなウスチラゴ (*Ustilago*) 種 ;

例えばペリキュラリア ササキ (Pellicularia sasakii) のようなペリキュラリア (*Pellicularia*) 種 ;

例えばピリクラリア オリーゼ (*Pyricularia oryzae*) のようなピリクラリア (*Pyricularia*) 種 ;

例えばフサリウム クルモラム (*Fusarium culmorum*) のようなフサリウム (*Fusarium*) 種 ;

例えばボトリティス シネレア (*Botrytis cinerea*) のようなボトリティス (*Botr*

ytis)種；

例えばセプトリア ノドラム (*Septoria nodorum*) のようなセプトリア (*Septoria*) 種；

例えばレプトスファエリア ノドラム (*Leptosphaeria nodorum*) のようなレプトスファエリア (*Leptosphaeria*) 種；

例えばセルコスポーラ カネセンス (*Cercospora canescens*) のようなセルコスポーラ (*Cercospora*) 種；

例えばアルテルナリア ブラッシカエ (*Alternaria brassicae*) のようなアルテルナリア (*Alternaria*) 種、ならびに例えばシュードセルコスボ

レーラ ヘルボトリコイデス (*Pseudocercospora herpotrichoides*) のようなシュードセルコスボレーラ (*Pseudocercospora*) 種。

活性化化合物は、植物の病気を防除するために必要な濃度で、植物による耐性が良いと言う事実は、植物の空中部分、増殖用のストックおよび種子、ならびに土壌の処理を可能とする。

本発明の活性化化合物は、例えばセファエロセカ (*Sphaerotheca*) 種およびベンチュリア種 (*Venturia*) 種に対するブドウ栽培ならびに果実および野菜の成長における病気を防除するために、あるいは例えばシュードペロノスポーラ (*Pseudocercospora*) 種に対する穀物の病気を防除するために、あるいは例えばピリクラリア オリーゼ (*Pyricularia oryzae*) に対するイネの病気を防除するために成功裏に使用される。セプトリア (*Septoria*)、コクリオボラス (*Cochliobolus*) およびピレノフォーラ (*Pyrenophora*) 種のような他の穀物の病気も、成功裏に防除される。フィトファソーラ (*Phytophthora*)、プラスモパラ (*Plasmopara*)、ポドスファエラ (*Podosphaera*) およびボトリティス (*Botrytis*) 種のようなブドウ栽培ならびに果実および野菜の成長における他の病気も、成功裏に防除される。

活性化化合物の特定の物理および／または化学的特性に依存して、それらを溶剤、乳剤、懸濁液、粉剤、発泡剤、ペースト、粒剤、エアゾール、ポリマー性物質中へのマイクロカプセル化、および種子用のコーティング組成物中に、ならびに ULV コールドおよびウォームミスト組成物のような通例の組成物に転換できる。

これらの組成物は、例えば活性化化合物を増量剤、すなわち液体溶媒、加圧下の液化ガスおよび／または固体キャリアーと混合し、場合によっ

ては界面活性剤、すなわち乳化剤および／または分散剤および／または発泡剤を使用することにより、周知の様式により調製される。増量剤として水を使用する場合、有機溶媒は例えば補助溶媒としても使用できる。次のものは液体溶媒として主に適する；芳香族（キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレンのような）、塩化芳香族または塩化脂肪族炭化水素（クロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレンのような）、脂肪族炭化水素（シクロヘキサンまたはパラフィンのような、例えば鉱物油画分）、アルコール（ブタノールまたはグリコールのような）およびそれらのエーテルおよびエステル、ケトン（アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノンのような）、強い極性溶媒（ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルフォキシドのような）ならびに水である。液化ガス増量剤またはキャリアーは、周囲温度および大気圧でガス状である液体を意味すると考えられ、例えばハロゲン化炭化水素ならびにブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素のようなエアゾール噴射剤である。適当な固体キャリアーは：例えば挽いた天然鉱物（カオリン、クレー、タルク、白亜、珪砂、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたは珪藻土のような）、および挽いた人工鉱物（微細に分割されたシリカ、アルミナまたは珪酸塩のような）である。適当な粒剤用の固体キャリアーは：例えば方解石、大理石、軽石、海泡石および苦灰石のような粉碎し、そして分画した天然岩石、ならびに無機および有機粗挽き粉の合成顆粒、および有機材料の顆粒（おが屑・ヤシ殻、トウモロコシ穂軸およびタバコ茎のような）である。適当な乳化剤および／または発泡剤は：例えば、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル（例えばアルキルアリ

ールポリグリコールエーテル）、アルキルスルホネート、アルキルスルフェート、アリールスルホネートのような非イオン性およびアニオン性の乳化剤、ならびにタンパク質加水分解物である。分散助剤として適当であるのは、例えばリグニ

ンースルフィット廃液およびメチルセルロース。

粉末、顆粒またはラテックス状態（アラビアガムのような）のカルボキシメチルセルロースならびに天然および合成のポリマー、ポリビニルアルコールおよびポリビニルアセテートのような接着剤、ならびに天然のホスホリビッド（セファリンおよびレシチンのような）および合成ホスホリビッドを組成物中に使用できる。他の添加剤は、鉱物および植物油であることができる。

例えば酸化鉄、酸化チタンおよびプロシアンブルーのような無機顔料、ならびにアリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料のような有機染料のような着色料、ならびに鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩のような微量栄養素を使用することが可能である。

組成物は一般的に、0.1—95重量パーセント、好ましくは0.5—90%の活性化化合物を含む。

本発明の活性化化合物はそれ自体またはそれらの組成物状態で、既知の殺菌・カビ剤、殺バクテリア剤、殺ダニ剤、殺線虫剤または殺虫剤との混合物として、例えば作用スペクトルを広げるために、または抵抗性の確立を防止するために使用できる。多くの場合で相乗効果が得られ、すなわち混合物の活性は個々の成分の活性よりも大きい。

混合物中の適当な成分の例は以下の化合物である：

殺菌・殺カビ剤：

アルジモルホ、アムプロビルホス、アムプロビルホス—カリウム、アンドプリム、アニラジン、アザコナゾール、アゾキシストロビン、
ベナラキシル、ベノダニル、ベノミル、ベンザマクリル、ベンザマクリル—イソブチル、ピアラフォス、ピナパクリル、ピフェニル、ピタータノール、プラスチシジン-S、プロムコナゾール、ピリメート、ブチオベート、
カルシウムポリスルフィド、カビシマイシン、カブタホル、カブタン、カルベンダジン、カルボキシシン、カルボン、キノメチオネート、クロベンチアゾン、クロルフェナゾール、クロロネブ、クロロピクリン、クロロサロニル、クロノリネート、クロジラコン、クフラネブ、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニ

ル、シプロフラム、
デバカルブ、ジクロロフェン、ジクロブトラゾール、ジクロフルアニド、ジクロ
メジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジメチリモー
ル、ジメトモルホ、ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、ジノカブ、ジフェニ
ルアミン、ジピリチオン、ジタリムホス、ジチアノン、ドデモルホ、ドジン、ド
ラゾキシロン、
エジフェンホス、エボキシコナゾール、エタコナゾール、エチリモール、エトリ
ジアゾール、
ファモキサドン、フェナパニル、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフ
ラム、フェニトロパン、フェンピクロニル、フェンプロビジン、フェンプロピモ
ルホ、フェンチンアセテート、フェンチンヒドロキシド、フェルバム、フェリム
ゾン、フルアジナム、フルメトオーバー、フルオロミド、フルキノコナゾール、
フルブリミドル、フルシラゾル、フ

ルスルファミド、フルトラニル、フルトリアホル、ホルベット、ホセチルーアル
ミニウム、ホセチルーナトリウム、フタリド、フベリダゾール、フララキシル、
フラメトビル、フルカルボニル、フルコナゾール、フルコナゾール-シス、フル
メシクロックス、

グアザチン、

ヘキサクロロベンゼン、ヘキサコナゾール、ヒメキサゾル、

イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジン、イミノクタジネアルベシレ
ート、イミノクタジントリアセテート、ヨードカルブ、イブコナゾール、イプロ
ベンホスフェン (IBP)、イプロジオン、イルママイシン、イソプロチオラン、イ
ソバレジオン、

カスガマイシン、クレソキシム-メチル、銅調製物：例えば水酸化銅、ナフテン
酸銅、銅オキシクロライド、硫酸銅、酸化銅、オキシニ-銅およびボルドー混合
物、

マンコッパー、マンコゼブ、マネブ、メルフェリムゾン、メパニピリム、メブ
ロニル、メタラキシル、メトコナゾール、メタスルホカルブ、メトフロキサム、

メチラム、メトリラム、メトスルホパックス、ミルジオマイシン、ミクロブタニ
ル、ミクロゾリン、
ニッケル ジメチルジチオカルバメート、ニトロサル－イソプロピル、ニューリ
モル、オフラス、オキサジキシル、オキサモカルブ、オキシリニノクアシッド
、オキシカルボキシム、オキシフェンチン、
バクロブトラゾール、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシキュロン、ホス
ジフェン、ピマリシン、ピペラリン、ポリオキシシ、ポリオキシリム、プロベナ
ゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、プロパノシン－ナトリ
ウム、プロピコナゾール、プロピネブ、ピラ

ゾホス、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピロキロン、ピロキシフル、キンコ
ナゾール、キントズセン(PCNB)、

硫黄および硫黄調製物、

テブコナゾール、テクロフタラム、テクナゼン、テトサイクラシス、テトラコナ
ゾール、チアベンダゾール、チシオフエン、チフルザミド、チオファネート－メ
チル、チラム、チオキシミド、トルクロホス－メチル、トリルフルアニド、トリ
アジメホン、トリアジメノール、トリアズブタニル、トリアゾキシド、トリクラ
ミド、トリシクラゾール、トリデモルホ、トリフルミゾール、トリホリン、トリ
チコナゾール、

ユニコナゾール、

バリダマイシンA、ピンクロゾリン、ピニコナゾール、

ザリラミド、ジネブ、ジラム、ならびまた

Dagger G、

OK-8705、

OK-8801、

2', 6'-ジブromo-2-メチル-4'-トリフルオロメトキシ-4'-トリフルオロ-メチル-1
, 3-チアゾール-5-カルボキサニリド

2, 6-ジクロロ-N-(4-トリフルオロメチルベンジル)-ベンズアミド

2-アミノブタン、

2-フェニルフェノール(OPP)、
8-ヒドロキシキノリンスルフェート、
シス-1-(4-クロロフェニル)-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾリ-1-イル)-シクロヘプタノール、
(5RS, 6RS)-6-ヒドロキシ-2, 2, 7, 7-テトラメチル-5-(1H-1, 2, 4-トリアゾ

リ-1-イル)-3-オクタノン、
 α -(2, 4-ジクロロフェニル)- β -メトキシ- α -メチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-エタノール、
 α -(1, 1-メチルエチル)- β -(フェノキシエチル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-エタノール、
1-[1-[2-[(2, 4-ジクロロフェニル)メトキシ]フェニル]エチル]-1H-イミダゾール、
ビス-(1-メチルエチル)-3-メチル-4-[(3-メチルベンゾイル)オキシ]-2, 5-チオフェン ジカルボキシレート、
2, 6-ジクロロ-N-[[4-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル]-ベンズアミド、
(E)- α -(メトキシイミノ)-N-メチル-2-フェノキシ-フェニルアセトアミド、
9H-キサンテン-9-カルボ-2-[(フェニルアミノ)-カルボニル]-ヒドラジド、
O-メチル S-フェニル フェニルプロピルホスホルアミドチオエート、
N-(5-クロロ-2-メチルフェニル)-2-メトキシ-N-(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)-アセトアミド、
1-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾリ-1-イル)エタノンO-(フェニルメチル)-オキシム、
N-(2, 6-ジメチルフェニル)-2-メトキシ-N-(テトラヒドロ-2-オキソ-3-チエニル)-アセトアミド、
シス-4-[3-[4-(1, 1-ジメチルプロピル)-フェニル-2-メチルプロピル]-2, 6-ジメチル-モルホリン ヒドロクロライド、

α -(2, 4-ジクロロフェニル)- β -フルオロ- β -プロピル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-

1-エタノール、
 3-(1,1-ジメチルプロピル)-1-オキソ-1H-インデン-2-カルボニトリル、
 2,6-ジクロロ-5-(メチルチオ)-4-ピリミジニルチオシアネート、
 5-メチル-1,2,3-ベンゾチアジアゾール-7-カルボチオエート、
 N-(6-メトキシ)-3-ピリジニル)-シクロプロパンカルボキサミド、
 3,5-ジクロロ-N-[シアノ[(1-メチル-2-プロピニル)オキシ]メチル]-ベンズアミ
 ド、
 4-クロロ-2-シアノ-N,N-ジメチル-5-(4-メチルフェニル)-1H-イミダゾール-1-ス
 ルホンアミド、
 8-(1,1-ジメチルエチル)-N-エチル-N-プロピル-1,4-ジオキサスピロ[4,5]デカン
 -2-メタンアミン、
 2,2-ジクロロ-N-[1-(4-クロロフェニル)エチル]-1-エチル-3-メチル-シクロプロ
 パンカルボキサミド、
 N-(2,3-ジクロロ-4-ヒドロキシフェニル)-メチル-シクロヘキサンカルボキサミ
 ド、
 1-(3,5-ジクロロフェニル)-3-(2-プロペニル)-2,5-ピロリジンジオン、
 1-メチル-5-ノニル-2-(フェニルメチル)-3-ピロリジノール、
 1-[[2-(4-クロロフェニル)-3-フェニルオキシラニル]-メチル]-1H-1,2,4-トリア
 ザール、
 メタンテトラチオール、ナトリウム塩、
 2-(2,3,3-トリヨード-2-プロペニル)-2H-テトラゾール、
 N-[3-クロロ-4,5-ビス(2-プロピニルオキシ)-フェニル]-N'-メトキシ-メタンイ
 ミダミド、

α -(5-メチル-1,3-ジオキササン-5-イル)- β -[[4-(トリフルオロメチル)-フェニル
]メチレン]-1H-1,2,4-トリアゾール-1-エタノール、
 1-(2-メチル-1-ナフタレニル)-1H-ピロール-2,5-ジオン、
 N-(2,6-ジメチルフェニル)-2-メトキシ-N-(テトラヒドロ-2-オキソ-3-フラニル)
 -アセトアミド、

3,4-ジクロロ-1-[4-(ジフルオロメトキシ)-フェニル]1H-ピロール-2,5-ジオン、
 N-[2,2,2-トリクロロ-1-[(クロロアセチル)-アミノ]-エチル]-ベンズアミド、
 N-ホルミル-N-ヒドロキシ-DL-アラニン、1ナトリウム塩、
 N-(4-シクロヘキシルフェニル)-1,4,5,6-テトラヒドロ-2-ピリミジンアミン、
 4-メチル-テトラゾロ[1,5-a]キナゾリン-5(4H)-オンム、2-クロロ-N-(2,6-ジメチルフェニル)-N-(イソチオシアナトメチル)-アセトアミド、
 エチル[(4-クロロフェニル)-アゾ]-シアノアセテート、
 N-(4-ヘキシルフェニル)-1,4,5,6-テトラヒドロ-2-ピリミジンアミン、
 N-(2-クロロ-4-ニトロフェニル)-4-メチル-3-ニトロ-ベンゼンスルホンアミド、
 メチル N-(クロロアセチル)-N-(2,6-ジメチルフェニル)-DL-アラニネート、
 3-[2-(4-クロロフェニル)-5-エトキシ-3-イソキサゾリジニル]-ピリジン、
 [2-メチル-1-[[[1-(4-メチル)エチル]アミノ]カルボニル]-プロピル]カルバミン
 -酸-1-メチル-レチルエステル、

2-[(1-メチルエチル)スルホニル]-5-(トリクロロメチル)-1,3,4-チアジアゾール
 、
 スピロ[2H]-1-ベンゾピラン-2,1'(3'H)-イソベンゾフラン]-3'-オン、
 メチル N-(2,6-ジメチルフェニル)-N-(5-イソキサゾリルカルボニル)-DL-アラニ
 ネート、炭酸水素カリウム塩、
 1-[[2-(2,4-ジクロロフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]-メチル]-1H-イミダ
 ザゾール、
 1-[(ジヨードメチル)-スルホニル]-4-メチル-ベンゼン、
 2-プロモ-2-(プロモメチル)-グルタロニトリル、
 2-[[6-デオキシ-4-O-(4-O-メチル-β-D-グリコピラノシル)-α-D-グルコピラノ
 シル]-アミノ]-4-メトキシ-1H-ピロロ[2,3,-d]ピリミジン-5-カルボニトリル、
 メチル 1-(2,3-ジヒドロ-2,2-ジメチル-1H-インデン-1-イル)-1H-イミダゾール-
 5-カルボキシレート、
 2-クロロ-N-(2,3-ジヒドロ-1,1,3-トリメチル-1H-インデン-4-イル)-3-ピリジン
 カルボキサミド、

0,0-ジエチル[2-(ジプロピルアミノ)-2-オキソエチル]-エチルホスホルアミドチオエート。

除草剤のような他の周知の活性化合物と、または化学肥料および生長調整物質との混合物も可能である。

本発明の活性化合物はそのまま、またはその市販されている組成物の状態で、または例えば即使用可能な溶剤、懸濁液、湿潤粉末、ペースト、可溶性粉末、粉剤および顆粒のような組成物から調製された状態で使用できる。それらは通常の様式、例えば給水、噴霧、霧吹き、散布、

発泡、ブラッシング等により使用される。適当であれば、活性化合物を微量法により施用し、あるいは活性化合物組成物または活性化合物自体を土壤に流入する。適当であれば、植物の種子も処理できる。

植物部分の処理では、使用状態の活性化合物濃度は、実質的範囲内で変動し得る。それらは一般的に、1から0.0001重量%の間、好ましくは0.5から0.001%の間である。

種子の処理では、1キログラムの種子あたり0.001-50g、好ましくは0.01-10gの活性化合物量が一般的に必要である。

土壤の処理では、0.00001-0.1重量%、好ましくは0.0001-0.2重量%の活性化合物濃度が作用部位で必要である。

活性化合物は、植物による耐性がよく、温血種に対する好ましい毒性を有し、そして動物有害生物、特に農業、林業、および貯蔵産物および材料の保護、ならびに衛生領域において遭遇する昆虫、蛛形類および線虫を防除するために適している。それらは好ましくは作物保護剤として使用できる。それらは通常は感受性である種および抵抗種に対して、ならびに発育のすべての、または或る段階で活性である。上記の有害生物には次のものを含む：

等脚類(Isopoda)から、例えばオニスカス アセルス(*Oniscus asellus*)、アルマジリジウム ブルガレ(*Armadillidium vulgare*)およびポルセリオ スカバー(*Porcellio scaber*)。

倍脚綱(Diplopoda)から、例えばブラニウラス ギュタラタス(*Blaniulus guttu*

latus)。

唇脚綱(Chilopoda)から、例えばゲオフィラス カルポファーガス(*Geophilus carpophagus*)およびスクチゲラ スペック(*Scutigera spec.*)。

結合類(Symphyla)から、例えばスカッチグレーラ イマカラータ(*Scutigereilla immaculata*)。

総尾目から、例えばレビスマ サッカリーナ(*Lepisma saccharina*)。

粘管目から、例えばオニキウラス アルマタス(*Onychiurus armatus*)。

跳躍目から、例えばブラッタ オリエンタリス(*Blatta orientalis*)、ペリプラネータ アメリカーナ(*Periplaneta americana*)、ロイコファーエア マデラエ(*Leucophaea maderae*)、ブラッテラ ゲルマニカ(*Blattella germanica*)、アケータ ドメスティカス(*Acheta domesticus*)、グリロタルパ種(*Gryllotalpa* spp.)、ローカスタ ミグラトリア ミグラトリオイデス(*Locusta migratoria migratorides*)、メラノプラス ディフェレンティアリス(*Melanoplus differentialis*)およびシストセルカ グレガリア(*Schistocerca gregaria*)。

革翅目から、例えばフォルフィクーラ オーリクラリア(*Forficula auricularia*)。

等翅目から、例えばレティキュリターメス種(*Reticulitermes* spp.)。

シラミ目から例えばペディキュラス ヒューマナスコルポリス(*Pediculus humanus corporis*)、ヘマトピナス種(*Haematopinus* spp.)およびリノグナタス種(*Linognathus* spp.)。

食毛目から、例えばトリコデクテス種(*Trichodectes* spp.)およびダマリネア種(*Damalinea* spp.)。

アザミウマ目から、例えばヘルシノトリプス フェモラリス(*Hercinothrips femoralis*)およびトリプス タバシ(*Thrips tabaci*)。

異翅目から、例えばユーリガスター種(*Eurygaster* spp.)、ディスダルカス インターメディウス(*Dysdercus intermedius*)、ピースマ クワ

ドラータ(*Piesma quadrata*)、シメックス レクタラリウス(*Cimex lectularius*)

、ロードニウス プロリキシス (*Rhodnius prolixus*) およびトリアトーマ種 (*Triatoma* spp.)。

同翅目から、例えばアレウロデス ブラッシカエ (*Aleurodes brassicae*)、ベミシア タバシ (*Bemisia tabaci*)、トリアロウロデス バポーラリオラム (*Trialeurodes vaporariorum*)、アフィス ゴシッピイ (*Aphis gossypii*)、ブレビコリネ ブラッシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、クリプトミズス リビス (*Cryptomyzus ribis*)、アフィス ファーバエ (*Aphis fabae*)、アフィス ポミ (*Aphis pomi*)、エリオソーマ ラニゲラム (*Eriosoma lanigerum*)、ヒアロプテラス アルンディニス (*Hyalopterus arundinis*)、フィルロックセラ バスタトリックス (*Phylloxera vastatrix*)、ペンフィガス種 (*Pemphigus* spp.)、マクロシファム アベナエ (*Macrosiphum avenae*)、ミズス種 (*Myzus* spp.)、フォロドン ヒュムリー (*Phorodon humuli*)、ロパロシファウム パディ (*Rhopalosiphum padi*)、エムポアスカ種 (*Empoasca* spp.)、エウセルリス バイロバタス (*Euscelis bilobatus*)、ネフォテティクスシンクティセプス (*Nephotettix cincticeps*)、レカニウム コルニ (*Lecanium corni*)、サイセッティア オレアエ (*Saissetia oleae*)、ラオデルファックス ストリアテルス (*Laodelphax striatellus*)、ニラパルバータ ルゲンス (*Nilaparvata lugens*)、アオニディエラ アウランティ (*Aonidiella aurantii*)、アスピジオタス ヘデラエ (*Aspidiotus hederae*)、シュードコッカス種 (*Pseudococcus* spp.) およびシエーラ種 (*Psylla* spp.)。

鱗翅目から、例えばベクチノホーラ ゴシッピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ブバラス ピニアリウス (*Bupalus piniarius*)、ケイマトビ

ア ブルマータ (*Cheimatobia brumata*)、リソコルレティス ブランカルデーラ (*Lithocolletis blancardella*)、ヒポノメウタ パデーラ (*Hyponomeuta padella*)、ブルテラ マキュリペンニス (*Plutella maculipennis*)、マラコソーマ ノウス トリア (*Malacosoma neustria*)、ユープロクティス クリソッロエア (*Euproctis chrysorrhoea*)、リマントリア種 (*Lymantria* spp.)、ブックラトリックス サーベリエーラ (*Bucculatrix thurberiella*)、フィロッコニスティス シトレーラ (*Phyllocnistis citrella*)、アグロティス種 (*Agrotis* spp.)、ユークソア種 (*Euxoa* sp.)

p.)、フェルティア種(*Feltia* spp.)、エアリアス インスラーナ(*Earias insulana*)、ヘリオディス種(*Heliothis* spp.)、スポドプテラ エキシギア(*Spodoptera exigua*)、マメストラ ブラシカエ(*Mamestra brassicae*)、パノリス フランメア(*Panolis flammea*)、スポドプテラ リツラ(*Spodoptera litura*)、スポドプテラ種(*Spodoptera* spp.)、トリコプルシア ニー(*Trichoplusia ni*)、カルポカプサ ポモネーラ(*Carpocapsa pomonella*)、ピエリス種(*Pieris* spp.)、キロ種(*Chilo* spp.)、ピラウスタ ヌビラリス(*Pyrausta nubilalis*)、エフェスティア クエニエーラ(*Ephestia kuehniella*)、ガレリア メローネーラ(*Galleria mellonella*)、チネオラ ビッセリーエーラ(*Tineola bisselliella*)、チネア ペリオネーラ(*Tinea pellionella*)、ホフマンノフィラ シュードスプレターラ(*Hofmannophila pseudospretella*)、カコエシア ポダナ(*Cacoecia podana*)、カプア レチクラナ(*Capua reticulana*)、コリストネウラ フミフェラーナ(*Choristoneura fumiferana*)、クリシア アンビギユエーラ(*Clysia ambiguella*)、ホモナ マグナニマ(*Homonoma magnanima*)およびトリトリックス ビリダナ(*Tortrix viridana*)。

甲虫目の例として、例えばアノビウム パンクタタム(*Anobium punctatum*)、リゾペルサ ドミニカ(*Rhizopertha dominica*)、ブルチディウス オブテクタス(*Bruchidius obtectus*)、アカントセリデス オブテクタス(*Acanthoscelides obtectus*)、ヒロトルペス バジュラス(*Hylotrupes bajulus*)、アゲラスティカ アルニ(*Agelastica alni*)、レプチノタルサデセムリネアーター(*Leptinotarsa decemlineata*)、フェドン コーチレアリアエ(*Phaedon cochleariae*)、ディアプロティカ種(*Diabrotica* spp.)、シリオデス クリソセファーラー(*Psylliodes chrysocephala*)、エピラキナ パリベステイス(*Epilachna varivestis*)、アトマリア種(*Atomaria* spp.)、オリーゼフィラス スリナメンシス(*Oryzaephilus surinamensis*)、アントノーマス 種(*Anthonomus* spp.)、シトフィラス種(*Sitophilus* spp.)、オチオロリンカス スルカタス(*Otiorrhynchus sulcatus*)、コスモポリテス ソルディダス(*Cosmopolites sordidus*)、シュートリンカス アシミリス(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、ヒベラ ポスティカ(*Hypera postica*)、ダーメステス種(*Dermestes* spp.)、トロゴダーマ種(*Trogoderma* spp.)、アントレナス種(*Anthrenus* spp.)

、アタゲナス種(*Attagenus* spp.)、リクタス種(*Lyctus* spp.)、メリゲセスアエネウス(*Meligethes aeneus*)、プチナス種(*Ptinus* spp.)、ニプタス ホロロカス(*Niptus hololeucus*)、ギッビウム シロイデス(*Gibbium psylloides*)、トリボリウム種(*Tribolium* spp.)、テネブリオ モリトール(*Tenebrio molitor*)、アグリオテス種(*Agriotes* spp.)、コノデラス種(*Conoderus* spp.)、メロロンサ メロロンサ(*Melolontha melolontha*)、アンフィマローン ソルスティティアリス(*Amphimallon solstitialis*)およびコステリトラ ゼアランディカ(*Costelytra zealandica*)。

膜翅目から、例えばディプリオン種(*Diprion* spp.)、ホプロカンパ種(*Hoplocampa* spp.)、ラシウス種(*Lasius* spp.)、モノモリウム ファラオニス(*Monomorium pharaonis*)およびベスパ種(*Vespa* spp.)。

双翅目から、例えばアエデス種(*Aedes* spp.)、アノフェラス種(*Anopheles* spp.)、クレックス種(*Culex* spp.)、ドロソフィリア メラノガスター(*Drosophila melanogaster*)、ムスカ種(*Musca* spp.)、ファンニア種(*Fannia* spp.)、カリポーラエリスロセファラ(*Calliphora erythrocephala*)、ルシリア種(*Lucilia* spp.)、クリソマイヤ種(*Chrysomya* spp.)、クテレブラ種(*Cuterebra* spp.)、ガストロフィラス種(*Gastrophilus* spp.)、ヒッポボスカ種(*Hippobosca* spp.)、ストモキシス種(*Stomoxys* spp.)、オエストラス種(*Oestrus* spp.)、ハイポダーマ種(*Hypoderma* spp.)、タバナス種(*Tabanus* spp.)、タンニア種(*Tannia* spp.)、ビビオホルチュラナス(*Bibio hortulanus*)、オシネーラ フリット(*Oscinella frit*)、フォルビア種(*Phorbia* spp.)、ペゴミア ヒオシヤミ(*Pegomya hyoscyami*)、セラティティス カピタタ(*Ceratitis capitata*)、ダカス オレアエ(*Dacus oleae*)およびチプーラ パルドーサ(*Tipula paludosa*)。

微翅目から、例えばキシノシーラ チェオピス(*Xenopsylla cheopis*)、セラトフィラス種(*Ceratophyllus* spp.)およびシテノスファリデス フェリス(*Ctenocephalides felis*)。

蛛形類(*Arachnida*)から、例えばスコルピオ マウラス(*Scorpio maurus*)およびラトロデクタス マクタンズ(*Latrodectus mactans*)。

ダニ目から、例えばアカラス シロ (*Acarus siro*)、アルガス種 (*Argas spp.*)、オルニソドロス種 (*Ornithodoros spp.*)、ダーマニスサス ガリ

ナエ (*Dermanyssus gallinae*)、エリオフィエス リビス (*Eriophyes ribis*)、フィロコプトルタ オレイボラ (*Phyllocoptruta oleivora*)、ボーフィリス種 (*Boophilus spp.*)、リピセファラス種 (*Rhipicephalus spp.*)、アンブリオンマ種 (*Amblyomma spp.*)、ハイアロンマ種 (*Hyalomma spp.*)、イクソデス種 (*Ixodes spp.*)、ソロプテス種 (*Psoroptes spp.*)、コリオプテス種 (*Chorioptes spp.*)、サルコプテス種 (*Sarcoptes spp.*)、タルソネムス種 (*Tarsonemus spp.*)、プリオビア プラエチオーサ (*Bryobia praetiosa*)、パノニカス種 (*Panonychus spp.*) およびテトラニカス種 (*Tetranychus spp.*)。

植物寄生性の線虫には、例えばブラチレンカス種 (*Pratylenchus spp.*)、ラドホーラス シミリス (*Radopholus similis*)、ディチレンカス ディプサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、チレニクラス セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*)、ヘテロデーラ種 (*Heterodera spp.*)、グロボデーラ種 (*Globodera spp.*)、メロイドギーネ種 (*Meloidogyne spp.*)、アフエレンコイデス種 (*Aphelenchoides spp.*)、ロンギドラス種 (*Longidorus spp.*)、キシフィネーマ種 (*Xiphinema spp.*) およびトリコドラス種 (*Trichodorus spp.*) を含む。

本発明の式(I)の化合物は、特にマスタードビートル (*mustard beetle*) (*Phaedon cochleariae*) の幼虫、コナガ (*Plutella maculipennis*)、シロナヤガ (*Spodoptera frugiperda*) の幼虫に対して、ならびにツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*) に対するそれらの活性により区別される。

活性化化合物を、溶剤、乳剤、湿潤粉末、懸濁液、粉剤、散布剤、ペースト、可溶性粉剤、粒剤、サスペンション-エマルジョン製剤、活性成

分を含浸させた天然および合成の物質、およびポリマー性物質中へのカプセル化のような通例の組成物に転換できる。

これらの組成物は、例えば活性化化合物を増量剤、すなわち液体溶媒および/または固体キャリアーと混合し、場合によっては界面活性剤、すなわち乳化剤およ

び／または分散剤および／または発泡剤を使用することにより、周知の様式により調製される。

増量剤として水を使用する場合、有機溶媒は例えば補助溶媒としても使用できる。以下のものは液体溶媒として主に適する；芳香族（キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレンのような）、塩化芳香族および塩化脂肪族炭化水素（クロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレンのような）、脂肪族炭化水素（シクロヘキサンまたはパラフィンのような、例えば鉱物油画分、鉱物および植物油）、アルコール（ブタノールまたはグリコールのような）およびそれらのエーテルおよびエステル、ケトン（アセトン、メチル エチル ケトン、メチル イソブチル ケトンまたはシクロヘキサノンのような）、強い極性溶媒（ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルフォキシドのような）ならびに水である。

適当な固体キャリアーは：

例えばアンモニウム塩および挽いた天然鉱物（カオリン、クレイ、タルク、白亜、珪砂、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたは珪藻土のような）、および挽いた人工鉱物（高度に分割されたシリカ、アルミナおよび珪酸塩のような）、粒剤用の適当な固体キャリアーは：例えば方解石、大理石、軽石、海泡石および苦灰石のような粉碎し、そして分画した天然岩石、ならびに無機および有機粗挽き粉の合成顆粒、および有機材料の顆粒（おが屑、ヤシ殻、トウモロコシ穂軸およびタバコ茎のよ

うな）；適当な乳化剤および／または発泡剤は：例えば、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル（例えばアルキルアリールポリグリコールエーテル）、アルキルスルホネート、アルキルスルフェート、アリールスルホネートのような非イオン性およびアニオン性の乳化剤、ならびにタンパク質加水分解物；適当な分散助剤は、例えばリグニンスルフィット廃液およびメチルセルロース。

カルボキシメチルセルロース、ならびにアラビアガム、ポリビニルアルコールおよびポリビニルアセテート等を初めとする粉末、顆粒またはラテックス状態の天然および合成のポリマーのような接着剤、あるいは天然のホスホリピッド（セ

ファリンおよびレシチンのような) および合成ホスホリピッドを組成物中に使用できる。他の添加剤は、鉱物および植物油であることができる。

例えば酸化鉄、酸化チタンおよびプロシアンブルーのような無機顔料、ならびにアリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料のような有機染料のような着色料、ならびに鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩のような微量栄養素を使用することが可能である。

組成物は一般的に、0.1から95重量パーセントの間、好ましくは0.5から90%の間の活性化化合物を含む。

本発明の活性化化合物は市販されている組成物状で、およびそれら組成物から調製した使用状態で、殺虫剤、誘引剤、滅菌剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌・殺カビ剤、生長一調整物質または除草剤のような他の活性化化合物との混合物として存在できる。中でも殺虫剤には、例え

ばリン酸エステル、カーバメート、カルボキシレート、塩化炭化水素、フェニルウレアおよび微生物により生産された物質等を含む。

本発明の活性化化合物は、さらにその市販されている組成物の状態で、および相乗作用剤との混合物として、これらの組成物から調製された使用状態で存在できる。相乗作用剤とは、加える相乗作用剤自体が活性となる必要はないが、活性化化合物の作用を増大させる化合物である。

市販の組成物から調製された使用状態の活性化化合物含量は、広い範囲内で変動し得る。使用状態での活性化化合物の濃度は、0.0000001-95重量%、好ましくは0.0001から1重量%の間の活性化化合物である。

化合物は、使用状態に適する通常の様式で使用される。

衛生および貯蔵産物の有害生物に対して使用する時、活性化化合物は、木材およびクレーに対する優れた残効作用、ならびに石灰化物質に対する良好なアルカリ安定性により明らかに区別される。

本発明の活性化化合物は、植物、衛生および貯蔵産物の有害生物に対して活性であるだけでなく、獣医学分野において、ハードチック(hard tick)、ソフトチック(soft tick)、疥癬ダニ、ツツガムシ科、ハエ(刺し、そして吸血性の)、寄

生性のハエの幼虫、シラミ、ケシラミ、トリ (bird) シラミおよびノミのような動物寄生体 (外部寄生体) に対しても活性である。このような寄生虫には：

シラミ目から例えばヘマトピナス種 (*Haematopinus* spp.)、リノグナタス種 (*Linnognathus* spp.)、ペディキュラス種 (*Pediculus* spp.)、フィチラス種 (*Phthirus* spp.) およびソレノポテス種 (*Solenopotes* spp.)。

食毛目ならびに亜目である鈍角類 (*Amblycerina*) および細角類 (*Ischnocera*) から、例えばトリメノポン種 (*Trimenopon* spp.)、メノポン種 (*M*

enopon spp.)、トリノトン種 (*Trinoton* spp.)、ボビコーラ種 (*Bovicola* spp.)、ウェルネッキエーラ種 (*Werneckiella* spp.)、レピセントロン種 (*Lepikentron* spp.)、ダマリナ種 (*Damalina* spp.)、トリコデクテス種 (*Trichodectes* spp.) およびフェリコーラ種 (*Felicola* spp.)。

双翅目ならびに亜目である糸角類 (*Nematocera*) および短角類 (*Brachycera*) から、例えばアエデス種 (*Aedes* spp.)、アノフェラス種 (*Anopheles* spp.)、クレックス種 (*Culex* spp.)、シムリウム種 (*Simulium* spp.)、ユーシムリウム種 (*Eusimulium* spp.)、フェレボトマス種 (*Phlebotomus* spp.)、ルツゾマイヤ種 (*Lutzomyia* spp.)、クリコイデス種 (*Culicoides* spp.)、クリソップス種 (*Chrysops* spp.)、ヒボミトラ種 (*Hybomitra* spp.)、アチロタス種 (*Atylotus* spp.)、タバナス種 (*Tabanus* spp.)、ヘマトポタ種 (*Haematopota* spp.)、フィリポマイヤ種 (*Philipomyia* spp.)、ブラウラ種 (*Braula* spp.)、ムスカ種 (*Musca* spp.)、ヒドロタエア種 (*Hydrotaea* spp.)、ストモキシス種 (*Stomoxys* spp.)、ヘマトビア種 (*Haematobia* spp.)、モレリア種 (*Morellia* spp.)、ファンニア種 (*Fannia* spp.)、グロッシナ種 (*Glossina* spp.)、カリフォーラ種 (*Calliphora* spp.)、ルシリア種 (*Lucilia* spp.)、クリソマイヤ種 (*Chrysomyia* spp.)、ウオールファリタ種 (*Wohlfahrtia* spp.)、サルコファーガ種 (*Sarcophaga* spp.)、オエストラス種 (*Oestrus* spp.)、ハイポダーマ種 (*Hypoderma* spp.)、ガステロフィラス種 (*Gasterophilus* spp.)、ヒッポボスカ種 (*Hippobosca* spp.)、リポプテナ種 (*Lipoptena* spp.) およびメロファーガス種 (*Melophagus* spp.)。

微翅目から、例えばブレックス種 (*Pulex* spp.)、シテノスファリデス種 (*Cteno*

cephalides spp.)、キセノシーラ種(Xenopsylla spp)、セラト

フィラス種(Ceratophyllus spp.)。

異翅目から、例えばシメックス種(Cimex spp.)、トリアトーマ種(Triatoma spp.)、ロードニウス種(Rhodnius spp.)、パンストロンギラス種(Panstrongylus spp.)。

直翅目から、例えばブラッタ オリエンタリス(Blatta orientalis)、ペリプラネータ アメリカーナ(Periplaneta americana)、ブラッテラ ゲルマニカ(Blattella germanica)およびスぺーラ種(Supella spp.)。

ダニ目(コナダニ科)(Acarina(Acarida))の亜綱および後気門類(Meta-)および中気門類(Mesostigmata)から、例えばアルガス種(Argas spp.)、オルニソドラス種(Ornithodorus spp.)、オタビウス種(Otobius spp.)、イクソデス種(Ixodes spp.)、アンブリオンマ種(Amblyomma spp.)、ボーフィリス種(Boophilus spp.)、ダマセンター種(Dermacentor spp.)、ヘマフィサリス種(Haemaphysalis spp.)、ハイアロンマ種(Hyalomma spp.)、リピセファラス種(Rhipicephalus spp.)、ダーマニッスス種(Dermanyssus spp.)、ライリーチア種(Raillietia spp.)、ニューモニッスス種(Pneumonyssus spp.)、ステレノストーマ種(Sternostoma spp.)、バットローア種(Varroa spp.)

アクチネディダ(Actiniedida)(前気門類)およびアカリディダ(Acaridida)(無気門類)から例えば、アカラピス種(Acarapis spp.)、シェイレチエーラ種(Cheyletiella spp.)、オルニトシェイレチア種(Ornithocheyletia spp.)、マイオピア種(Myobia spp.)、ソレルゲーテス種(Psorergates spp.)、デモデックス種(Demodex spp.)、トロンビクーラ種(Trombicula spp.)、リストロフォーラス種(Listrophorus spp.)、アカラス種(Acarus spp.)、チロファーガス種(Tyrophagus spp.)、カロ

ギリファス種(Caloglyphus spp.)、ハイポデクテス種(Hypodectes spp.)、プテロリカス種(Pterolichus spp.)、ソロプテス種(Psoroptes spp.)、コリオプテス種(Chorioptes spp.)、オトデクテス種(Otodectes spp.)、サルコプテス種(Sarcoptes spp.)

rcoptes spp.)、ノトエドレス種(Notoedres spp.)、キネミドコブテス種(Knemidocoptes spp.)、シトディテス種(Cytodites spp.)、ラミノシオプテス種(Lamiosioptes spp.)を含む。

本発明の式(I)の活性化化合物は、例えば畜牛、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、ロバ、ラクダ、パツファロー、ウサギ、ニワトリ、七面鳥、カモ、アヒル、ガン、ミツバチのような農業用の家畜、例えばイヌ、ネコ、かごの中の鳥、水槽中の魚のような他の飼育動物、および例えばハムスター、モルモット、ラットおよびマウスのような、いわゆる実験動物を攻撃する節足動物を防除するためにも適する。これらの節足動物を防除することにより、死および品質の低下を減らす(肉、ミルク、ウール、皮、卵、ハチミツ等)ことを意図し、本発明の活性化化合物を使用することにより、より経済的かつ簡単な動物維持が可能になる。

獣医学的には、本発明の活性化化合物は、例えば錠剤、カプセル、飲料、水薬、粒剤、ペースト、丸薬、かいば桶一法(feed-through method)、坐薬状の腸溶性投与により、例えば注射(筋肉内、皮下、静脈、腹腔等)、インプラント、点鼻投与のような非経口投与により、例えば浸漬またはパーシング(bathing)、噴霧、流す、およびスポット付加、洗浄、清掃の状態での経皮的投与により、ならびに活性化化合物を含んで成るカラー、耳タグ、尾の印、脚のバンド、頭絡、デバイスの作成等のような成型品の補助により、周知の様式で使用される。

家畜、家禽、飼育動物等に使用する時、活性化化合物を1-80重量%の

量で含んで成る組成物(例えば、粉剤、乳剤、フロアブル剤)として、式(I)の活性化化合物を直接的に、または100-10,000の因子で希釈した後のいずれかで使用することができ、あるいはそれらは薬浴の状態で使用してもよい。

さらに本発明の式(I)の化合物は、工業材料を破壊する昆虫に対して有力な殺虫活性を示すことが見いだされた。

以下の昆虫は、例として、そして好適として挙げることができるが、限定するものではない。

ヒロトルペス バジュラス(Hylotrupes bajulus)、クロロホーラス ピロシス(Chlorophorus pilosis)、アノビウム パンクタタム(Anobium punctatum)、キセス

トビウム ルホビロサム (*Xestobium rufovillosum*)、ピチリナス ペクチコルニス (*Ptilinus pecticornis*)、デンドロビウム ペルチネックス (*Dendrobium pertine x*)、エルノビウス モリス (*Ernobius mollis*)、プリオビウム カルピニ (*Priobium carpini*)、リクタス ブルネウス (*Lyctus brunneus*)、リクタス アフリカナス (*Lyctus africanus*)、リクタス プラニコリス (*Lyctus planicollis*)、リクタス リネアリス (*Lyctus linearis*)、リクタス プベッセンス (*Lyctus pubescens*)、トロゴキシロン アエクアーレ (*Trogoxylon aequale*)、ミンテス ルギコリス (*Minthes rugicollis*) ; キシレボーラス スペック (*Xyleborus spec.*)、トリプトデンドロン スペック (*Tryptodendron spec.*)、アパーテ モナカス (*Apate monachus*)、ボストリカス カプシンス (*Bostrychus capucins*)、ヘテロボストリカス ブルネウス (*Heterobostrychus brunneus*)、シノキシロン スペック (*Sinoxylon spec.*)、ジノデラス ミニュタス (*Dinoderus minutus*) のような甲虫。

シレックス ジュベンカス (*Sirex juvencus*)、ウルセラウス ギガス タイグナス (*Urocerus gigas taignus*)、ウルセラウス オーグル (*Urocerus augur*) のようなハサミムシ。

カローターメス フラビコリス (*Kaloterme flavicollis*)、クリプトターメス ブレビス (*Cryptoterme brevis*)、ヘテロターメス インディコーラ (*Heteroterme indicola*)、レティキュリターメス フラビペス (*Reticuliterme flavipes*)、レティキュリターメス サントネシス (*Reticuliterme santonesis*)、レティキュリターメス ルシフガス (*Reticuliterme lucifugus*)、マストターメス ダルウィニエンシス (*Mastoterme darwiniensis*)、ズーターモシス ネバデンシス (*Zootermopsis nevadensis*)、コプトターメス ホルムサヌス (*Coptoterme formosanus*) のようなシロアリ。

レピスマ サッカリーナ (*Lepisma saccharina*) のようなアザミウマ。

工業材料とは、本内容では、好ましくはポリマー、接着剤、サイズ剤、紙およびボード、なめし革、材木および得られる製材、ならびに塗料のような非生物材料を意味すると考える。

昆虫による攻撃から保護される材料は、大変特に好ましくは、木材および得ら

れる製材である。

本発明の薬剤またはそれを含んで成る混合物により保護できる木材および得られる製材は、例えば建材、木製の梁、線路の枕木、橋梁構成部材、突堤、木製の乗り物、箱、パレット、コンテナ、電柱、土留め板、木材でできた窓およびドア、合板、パーティクルボード、建具用工作物、またはきわめて一般的に家、建物または結合部に使用される建材を意味すると考える。

活性化化合物はそのまま、濃縮物の状態で、または粉末、粒剤、溶剤、懸濁液、乳液またはペーストのような一般的に通例の組成物で利用できる。

上記の組成物は、それ自体は周知の様式で、例えば活性化化合物を少なくとも1つの溶媒または希釈剤、乳化剤、分散剤および／または結合剤または定着剤、撥水剤と、適当であれば乾燥剤およびUV安定化剤、および適当であれば着色料および顔料、ならびに他の加工助剤と混合することにより調製できる。

木材および製材の保護のために使用される殺虫剤または濃縮剤は、本発明の活性化化合物を0.0001-95重量%、特に0.001-60重量%の濃度で含んで成る。

使用する組成物または濃縮剤の量は、種および昆虫の発生および媒体に依存する。使用する最適量は、個々の単一の場合における使用について一連の試験により決定することができる。しかし一般的に、保護される材料に基づき0.0001-20重量%、好ましくは0.001-10重量%の活性化化合物を使用することで十分である。

使用する溶剤および／または希釈剤は、有機化学溶媒または溶媒混合物および／または低揮発性の油性もしくは油一様の有機化学溶媒または溶媒混合物および／または極性有機化学溶媒もしくは溶媒混合物および／または水、ならびに適当ならば乳化剤および／または湿潤剤である。

使用する有機化学溶媒は、好ましくは約35より高い蒸発数および約30℃、好ましくは45℃より高い引火点を有する油性または油一様溶媒である。そのような水に不溶性の低揮発性の油性および油一様溶媒として使用される物質は、適当な鉱物油またはそれらの芳香族画分または鉱物油

を含んで成る溶媒混合物、好ましくはホワイトスピリット、石油および／アルキルベンゼンである。

170－220℃の沸点範囲を持つ鉱物油、170－220℃の沸点範囲を持つホワイトスピリット、250－350℃の沸点範囲を持つスピンドル油、160－280℃の沸点範囲を持つ石油または芳香族、テレピン精油等を使用することが有利である。

好適な態様では、使用される物質は、180－210℃の沸点範囲を持つ液体脂肪族炭化水素、または180－220℃の沸点範囲を持つ芳香族および脂肪族炭化水素の高沸点混合物、および／またはスピンドル油および／またはモノクロナフタレン、好ましくは α -モノクロナフタレンである。

35より高い蒸発数および約30℃より高い、好ましくは45℃より高い引火点を有する低揮発性の有機油性または油一様溶媒は、溶媒混合物が35より高い蒸発数および30℃より高い、好ましくは45℃より高い引火点持ち、しかも殺虫／殺菌・殺ダニ混合物がこの溶媒混合物に溶解性または乳化性であるならば、一部を中または高揮発性の有機化学溶媒に代えることができる。

好適な態様では、有機化学溶媒もしくは溶媒混合物または脂肪族の極性有機化学溶媒もしくは溶媒混合物の一部が置き換えられる。好ましく使用される物質は、例えばグリコールエーテル、エステル等のようなヒドロキシルおよび／またはエステルおよび／またはエーテル基を含む脂肪族有機化学溶媒である。

本発明の範囲内で使用される有機化学結合剤は、周知の結合乾燥油および／または合成樹脂であり、水で希釈することができ、かつ／または

使用する有機化学溶媒に可溶性、分散性もしくは乳化性であり、特にアクリレート樹脂、ビニル樹脂（例えばポリビニルアセテート）、ポリエステル樹脂、ポリ一縮合またはポリ一付加樹脂、ポリウレタン樹脂、アルキド樹脂もしくは修飾アルキド樹脂、フェノール樹脂、炭化水素樹脂（インデンクマロン樹脂のような）、シリコン樹脂、乾燥植物性および／または乾燥油および／または天然および／または合成樹脂に基づく物理的に乾燥した結合剤から成るか、または含んで成る。

結合剤として使用できる合成樹脂は、乳液、分散液または溶液の状態で使用で

きる。最高10重量%量のピチューメンまたはピチュメン物質も、結合剤として使用できる。さらに中でも周知の着色料、顔料、撥水剤、臭気回収剤および阻害剤または錆止め剤を使用できる。

本発明の組成物または濃縮物は、有機化学結合剤として、好ましくは少なくとも1つのアルキド樹脂または修飾アルキド樹脂および/または乾燥植物油を含んで成る。本発明に従い好ましく使用される物質は、45重量%、好ましくは50-68重量%より多い油含量を持つアルキド樹脂である。

上記の結合剤のすべて、または幾つかは、定着剤（混合物）または可塑剤（混合物）に代えることができる。これらの添加物は、活性化化合物の揮発または結晶化または沈殿を防ぐことを意図している。それらは好ましくは、0.01-30重量%の結合剤（使用する100%の結合剤に基づき）と置き換えられる。

可塑剤は、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレートまたはベンジルブチルフタレートのようなフタル酸エステル、トリブチルホスフェートのようなリン酸エステル、ジ-(2-エチルヘキシル)アジペートのよう

なアジピン酸エステル、ブチルステアレートまたはアミルステアレートのようなステアレート、ブチルオレートのようなオレート、グリセロールエーテルまたは高分子量グリコールエーテル、グリセロールエステルおよびp-トルエンスルホン酸エステルのような化学品からのものである。

定着剤は、例えばポリビニルメチルエーテルのようなポリビニルアルキルエーテル、またはベンゾフェノンおよびエチレンベンゾフェノンのようなケトンに化学的に基づいている。

別の適当な溶媒または希釈剤は、特に水であり、適当であれば1つ以上の上記有機化学溶媒または希釈剤、乳化剤および分散剤との混合物中の水である。

特に効果的な木材の保護は、工業的規模の浸漬法、例えば真空、二重真空または加圧法により行われる。

適当であれば、即使用可能な組成物は、他の殺虫剤を含んで成ることができ、そして適当であれば1つ以上の殺菌・殺カビ剤を含んで成ることもできる。

さらに混合することができる成分は、好ましくは欧州特許出願公開第94/29 26

8号明細書に述べられている殺虫剤および殺菌・殺カビ剤である。この明細書で述べられている化合物は、本発明の自明な部分である。

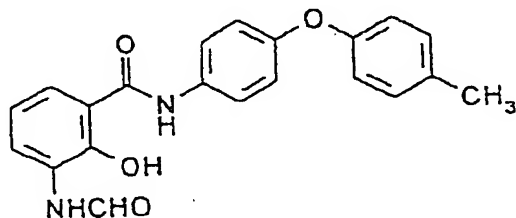
特に大変好ましく混合できる化合物は、クロルピリホス、ホキシム、シラフルオフィン、アルファメトリン、シフルトリン、シパーメトリン、デルタメトリン、パーメトリン、イミダクロピリド、NI-25、フルフェノキロン、ヘキサフルムロンおよびトリフルムロンのような殺虫剤、ならびにエボキシコナゾール、ヘキサコナゾール、アザコナゾール、プロピコナゾール、テブコナゾール、シプロコナゾール、メトコナゾール、

イマザリル、ジクロルフルアニド、トリルフルアニド、3-ヨード-2-プロピニルブチルカルバメート、N-オクチル-イソチアゾリン-3-オンおよび4,5-ジクロロ-N-オクチルイソチアゾリン-3-オンのような殺菌・殺カビ剤である。

本発明の活性化合物の製造および使用は、以下の実施例から理解できる：

製造例

実施例 1：



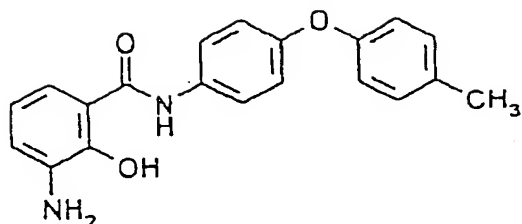
方法 a)

1. 67g(0.005モル)の3-(アミノ)-2-ヒドロキシ-N-(4-[4-(メチル)-フェノキシ]-フェニル)-ベンズアミドを、還流下で24時間、100mlのギ酸中で沸騰加熱する。すべての溶媒を減圧下で留去する。これにより0.72g(理論値40%)の3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシ-N-(4-[4-(メチル)-フェノキシ]-フェニル)-ベンズアミドを油として得る。

$^1\text{H-NMR}$: (CDCl_3/TMS) : $\delta = 6.80\text{--}7.85$ (m, 11H) ppm

出発化合物の製造

実施例(II-1)

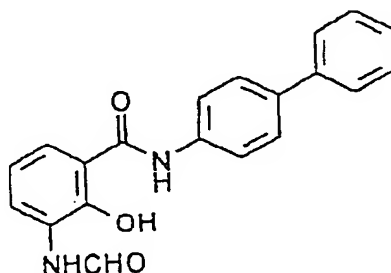


方法 a-1 a)

1.3g(0.0036モル)の3-ニトロ-2-ヒドロキシ-N-[4-(4-メチルフェノキシ)-フェニル]-ベンズアミド溶液(8mlのメタノール中)を、0.1gのラニーニッケルで処理し、そして20℃でオートクレープ中、3-9バーの圧力で水素を用いて水素化する。混合物中の未溶解成分を濾去し、そして濾液を減圧下で蒸発乾固する。これにより0.67g(理論値の56%)の3-アミノ-2-ヒドロキシ-N-[4-(4-メチルフェノキシ)-フェニル]-ベンズアミドを得る。

$^1\text{H-NMR}$: (CDCl_3)/TMS) : $\delta = 6.73-7.99(\text{m}, 11\text{H})\text{ppm}$

実施例 2



方法 b)

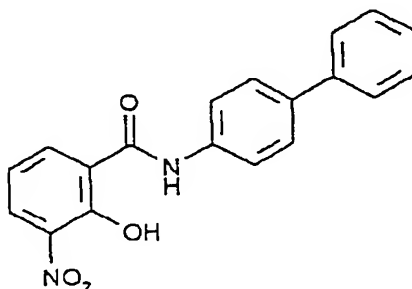
3g(0.0099モル)の3-ニトロ-2-ヒドロキシ-N-(4-フェニルフェニル)-ベンズアミドを、0.4gの10%活性炭担持パラジウムおよび10mlの水を用いて処理する。19mlのギ酸を続いて滴下し、そして混合物を110℃で2

時間加熱する。冷却した後、触媒を吸引濾去し、そして残渣を水で洗浄する。濾液はジクロロメタンを用いて抽出し、有機相を分離し、そして硫酸ナトリウム上

で乾燥し、そして溶媒を減圧下で留去する。これにより融点が190℃の1.4g(理論値48%)の3-ホルミルアミド-2-ヒドロキシ-N-(4-フェニルフェニル)-ベンズアミドを得る。

出発化合物の製造

実施例(IVa-1)

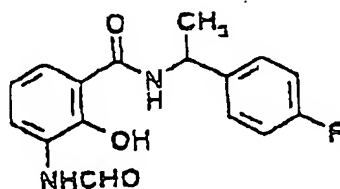


方法b-1)

15g(0.08モル)の3-ニトロサリチル酸、13.8g(0.08モル)の4-アミノビフェニルおよび18.5g(0.08モル)のビスクロヘキシルカルボジイミドを、400mlのピリジンに加え、そして攪拌した混合物を90℃で数時間加熱する。混合物を冷却し、そして濾過し、そして混合物を濃縮した後、200mlの10%塩酸を加え、そして混合物を200mlのジクロロメタンを使用して抽出する。合わせた有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして溶媒を真空で除去する。残渣をトルエンから再結晶する。

これにより16g(60%)の3-ニトロ-2-ヒドロキシ-N-(4-フェニルフェニル)-ベンズアミドを152℃が融点の黄色結晶として得る。

実施例3:



方法c)

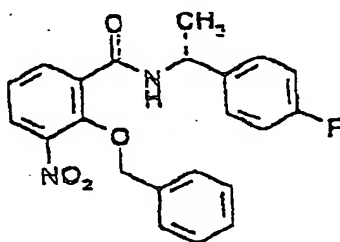
2.4g(0.006モル)の3-ニトロ-2-ベンジルオキシ-N-[-(4-フルオロフェニル)-エ

チル)-ベンズアミドを、0.6gの10%活性炭担持パラジウムおよび8mlの水で処理する。15mlのギ酸および0.9gの錫粉末をこの混合物に連続して加え、そして続いてバッチを5時間還流する。次に固体成分を吸引濾去し、そして濾液をジクロロメタンを用いて抽出する。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして減圧下で濃縮する。これにより1.1g(理論値の61%)の3-ホルムアミド-2-ヒドロキシ-N-[1-(4-フルオロフェニル)-エチル]-ベンズアミドを油として得る。

$^1\text{H-NMR}$: (CDCl_3/TMS) : $\delta = 1.62(\text{d}, 3\text{H})\text{ppm}$

出発化合物の製造

実施例(V-1) :



方法 a-2)

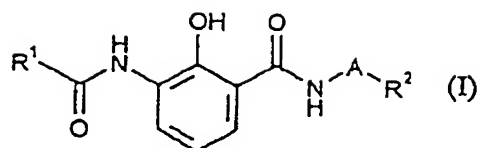
2.4g(0.011モル)のトリエチルアミンを -10°C で3g(0.011モル)の3-ニトロ-2-ベンジルオキシ安息香酸溶液(40mlのジクロロメタン中)に加え

る。混合物を5分間攪拌した後、2.8g(0.011モル)のイソブチルクロロホルメートを -10°C で滴下し、そして混合物をさらに30分間攪拌する。1.53g(0.011モル)の1-(4-フルオロフェニル)-エチルアミン溶液(10mlのジクロロメタン中)を -10°C で加え、さらに冷却することなく攪拌を12時間続行する。混合物を炭酸ハロゲンナトリウム溶液で処理し、そして有機相を分離し、水で洗浄し、そして硫酸ナトリウム上で乾燥する。溶媒を留去した後、2.5g(理論値の56%)の3-ニトロ-2-ベンジルオキシ-N-[1-(4-フルオロフェニル)-エチル]-ベンズアミドを油として得る。

$^1\text{H-NMR}$: (CDCl_3/TMS) : $\delta = 1.34(\text{d}, 3\text{H})\text{ppm}$

本発明の製造例1-3に準じて、ならびに方法一般的記載に従い得られる一般式(I)の他の化合物を、以下の表1に掲げる:

表 1



実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
4	H	-		NMR**: 6.90-8.54 (m, 12H)
5	H	-		m.p.: 100°C
6	H	-CH ₂ -		MS*: m/e = 270 (M ⁺)
7	H			NMR**: 1.62 (d, 3H)
8	H	-CH ₂ -CH ₂ -		NMR**: 3.85 (s, 3H); 3.88 (s, 3H)
9	H			MS*: m/e = 284 (M ⁺)
10	H			NMR**: 1.61 (d, 3H)
11	H			MS*: m/e = 314 (M ⁺)
12	H			NMR**: 1.24 (d, 3H)
13	H	-CH ₂ -		NMR**: 4.64 (d, 2H)

表 1 (続き)

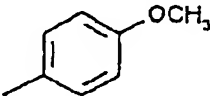

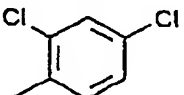

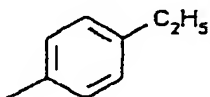
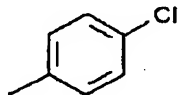
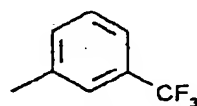
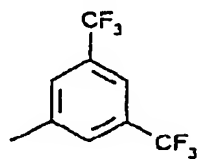
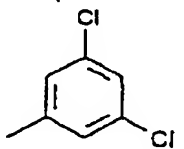
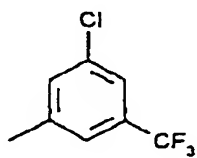
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
14	H	-CH ₂ -		m.p.: 142°C
15	H			m.p.: 74°C
16	H			NMR**: 1.62 (d, 3H)
17	H	-		logp.: 2.53
18	H	-		MS*: m/e = 324 (M ⁺)
19	H	-		MS*: m/e = 392 (M ⁺)
20	H	-		MS*: m/e = 324 (M ⁺ -1)
21	H	-		MS*: m/e = 358 (M ⁺)

表 1 (続き)

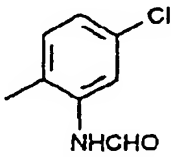
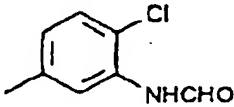
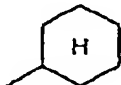
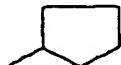

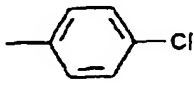
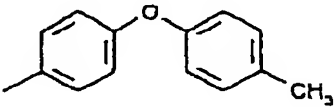
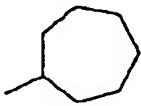
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
22	H	-		MS*: m/e = 333 (M ⁺)
23	H	-		MS*: m/e = 333 (M ⁺)
24	H	-	シクロドデシル	MS*: m/e = 346 (M ⁺)
25	H	-		logp.: 2.36
26	H	-		logp.: 2.04
27	H	-		logp.: 1.36
28	CH ₃	-		
29	CH ₃	-		logp.: 3.49
30	H	-		logp.: 2.71

表 1 (続き)

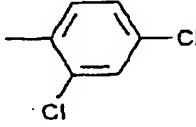
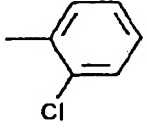

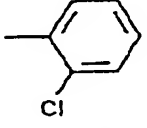
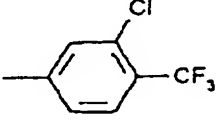
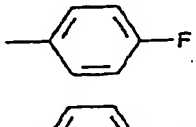
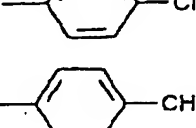
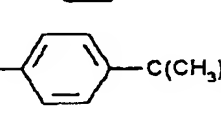
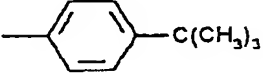
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
31	H	-CH ₂ -		logp.: 2.86
32	H	-CH ₂ -		logp.: 2.44
33	H			¹ H-NMR**: 1.64 (d, 3H)
34	H	-CH ₂ -		logp.: 2.94
35	H	-CH ₂ -		m.p.: 103°C
36	H	-CH ₂ -		logp.: 2.46
37	H	-CH ₂ -		logp.: 2.36
38	H	-CH ₂ -		logp.: 3.22

表 1 (続き)

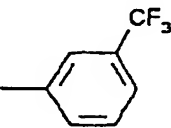
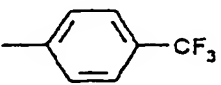
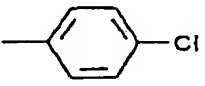
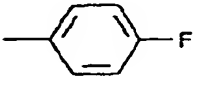
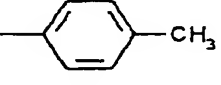
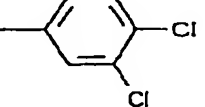
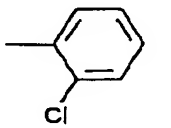
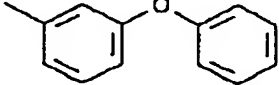
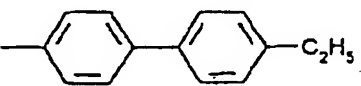
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
39	H	-CH ₂ -		m.p.: 110°C
40	H	-CH ₂ -		logp.: 2.65
41	H	-CH ₂ -CH ₂ -		m.p.: 140°C
42	H	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 2.32
43	H	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 2.59
44	H	-CH ₂ -CH ₂ -		MS*: m/e = 352 (M ⁺)
45	H	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 2.57
46	H	-CH ₂ -CH ₂ -		
47	H	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 5.26

表 1 (続き)

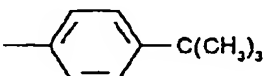
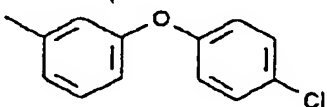
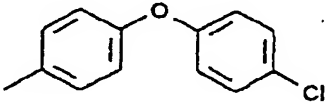

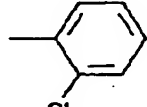

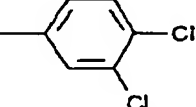

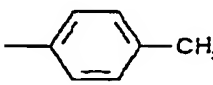

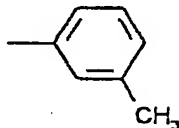

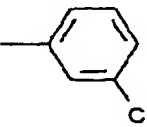
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
48	H	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 3.50
49	H	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 3.55
50	H	-CH ₂ -CH ₂ -		MS*: m/e = 410 (M ⁺)
51	H			logp.: 2.62
52	H			logp.: 3.03
53	H			logp.: 2.62
54	H			logp.: 2.59
55	H			

表 1 (続き)


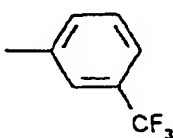

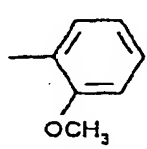

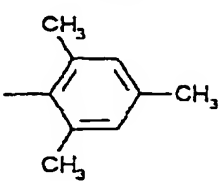

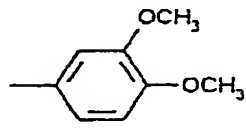

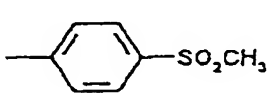

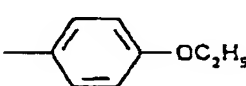

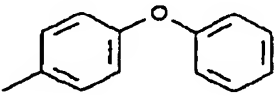

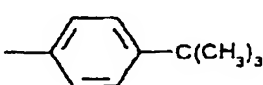
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
56	H			logp.: 2.85
57	H			logp.: 2.02
58	H			logp.: 3.09
59	H			
60	H			NMR**: 3.05 (s, 3H)
61	H			
62	H			logp.: 3.27
63	H			logp.: 3.51

表 1 (続き)


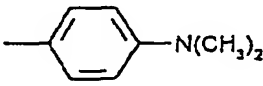

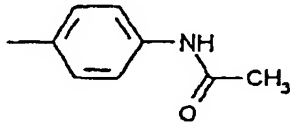

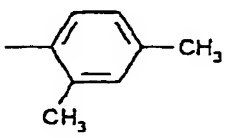

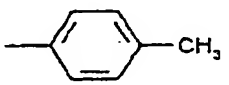

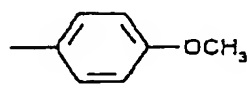
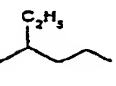
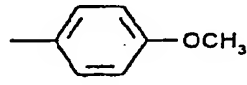

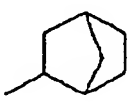

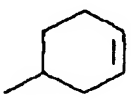

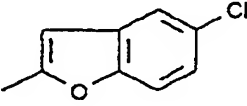
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
64	H			
65	H			
66	H			logp.: 2.92
67	H			logp.: 2.92
68	H			
69	H			
70	H			logp.: 3.14
71	H			logp.: 3.06
72	H			

表 1 (続き)


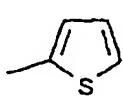
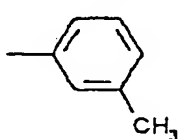
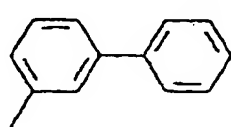
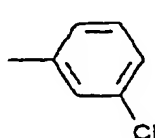
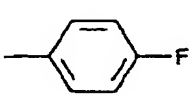
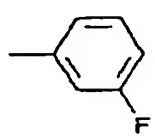
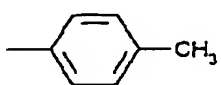
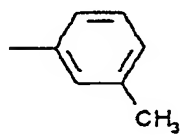
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
73	H			
74	H	-CH ₂ -		logp.: 2.38
75	H	-		
76	H	-		logp.: 2.52
77	H	-		logp.: 2.11
78	H	-		logp.: 2.18
79	H	-		logp.: 2.34
80	H	-		logp.: 2.33

表 1 (続き)

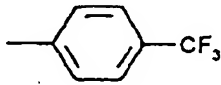
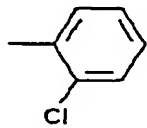
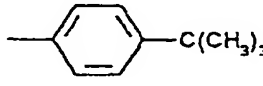
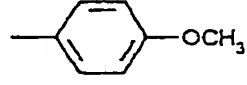
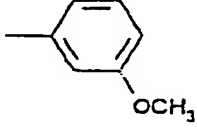
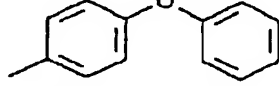
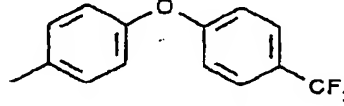
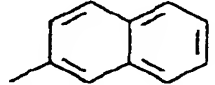
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
81	H	-		logp.: 2.79
82	H	-		logp.: 2.23
83	H	-		logp.: 3.32
84	H	-		
85	H	-		
86	H	-		logp.: 3.07
87	H	-		logp.: 3.68
88	H	-		logp.: 2.24

表 1 (続き)

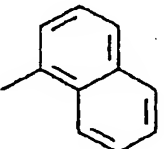
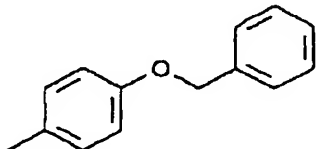
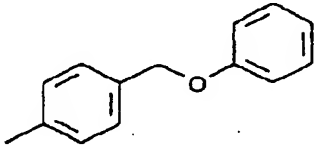
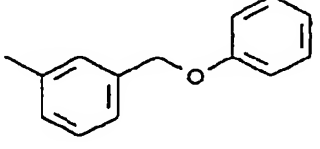
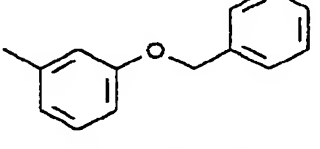
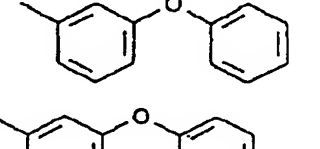
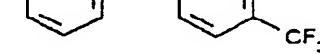
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
89	H	-		logp.: 2.35
90	H	-		MS*: m/e = 326 (M ⁺)
91	H	-		
92	H	-		logp.: 3.07
93	H	-		NMR **: 5.30 (s, 2H)
94	H	-		logp.: 3.12
95	H	-		logp.: 3.69

表 1 (続き)

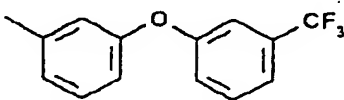
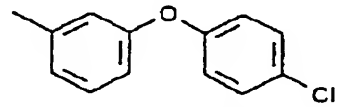
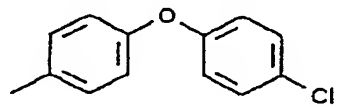
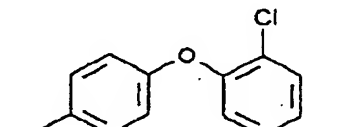
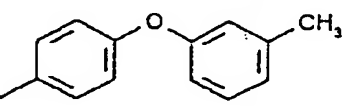
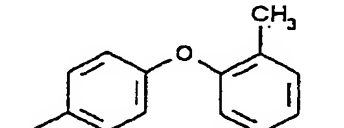
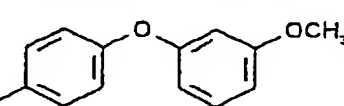
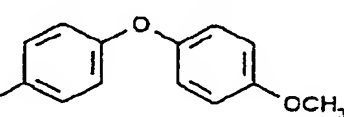
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
96	H	-		
97	H	-		logp.: 3.60
98	H	-		logp.: 3.56
99	H	-		logp.: 3.28
100	H	-		logp.: 3.41
101	H	-		logp.: 3.39
102	H	-		
103	H	-		

表 1 (続き)

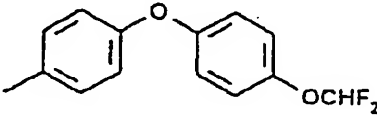
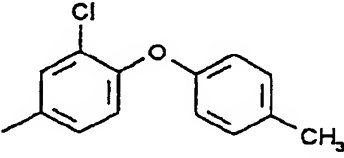
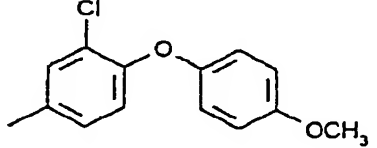
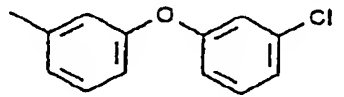
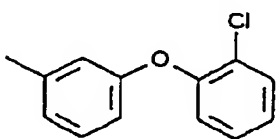
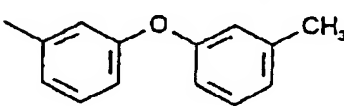
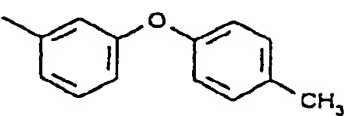
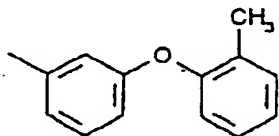
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
104	H	-		
105	H	-		
106	H	-		
107	H	-		logp.: 3.60
108	H	-		
109	H	-		logp.: 3.46
110	H	-		logp.: 3.47
111	H	-		

表 1 (続き)

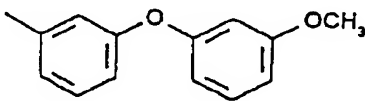
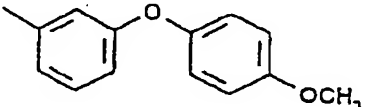
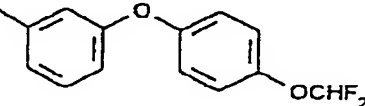
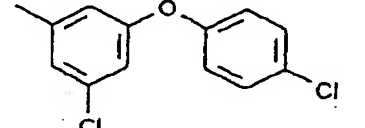
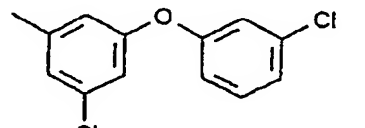
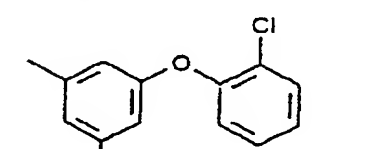
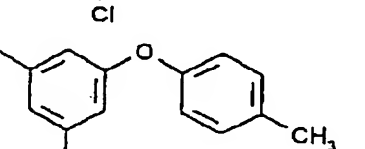
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
112	H	-		
113	H	-		
114	H	-		
115	H	-		
116	H	-		
117	H	-		
118	H	-		

表 1 (続き)

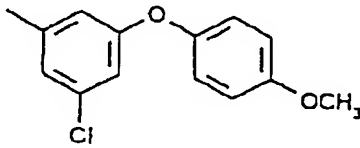
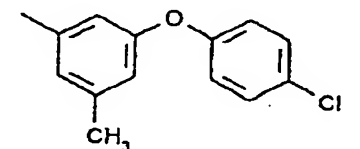
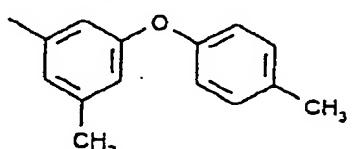
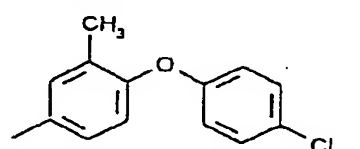
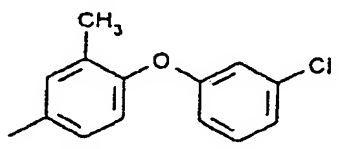
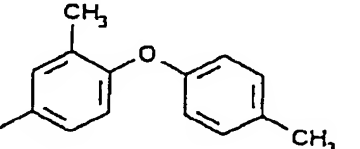
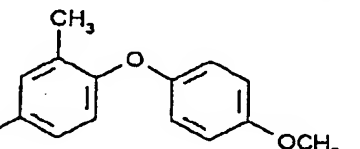
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
119	H	-		
120	H	-		
121	H	-		
122	H	-		logp.: 3.87
123	H	-		NMR**: 2.23 (s, 3H)
124	H	-		logp.: 3.74
125	H	-		

表 1 (続き)

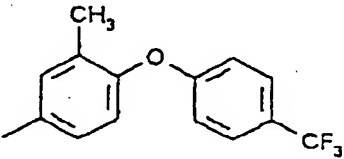
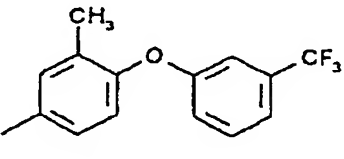
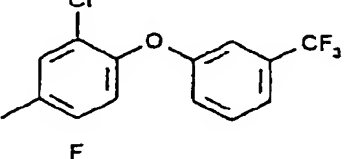
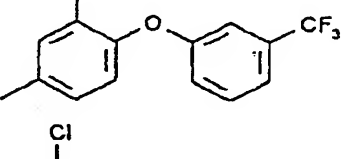
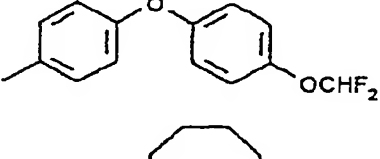
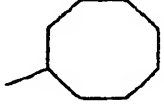
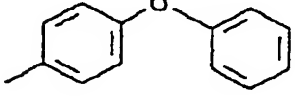
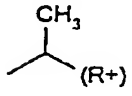
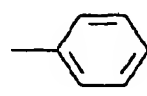
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
126	H	-		
127	H	-		
128	H	-		
129	H	-		
130	H	-		
131	H	-		logp.: 3.05
132	H	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 3.20
133	H	 (R+)		logp.: 2.26

表 1 (続き)

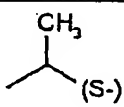
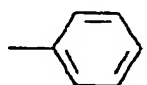
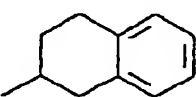
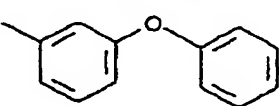
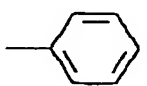
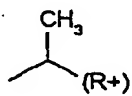
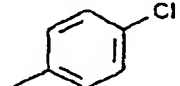
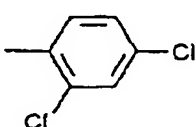
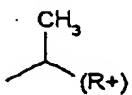
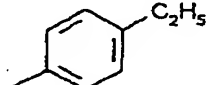
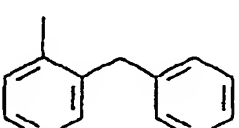
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
134	H			logp.: 2.26
135	H	-		logp.: 2.73
136	H	-CH ₂ -		logp.: 3.20
137	H	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 2.45
138	H			logp.: 2.70
139	H	H		logp.: 2.82
140	H			logp.: 2.96
141	H	-		logp.: 2.88

表 1 (続き)

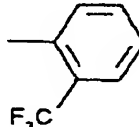
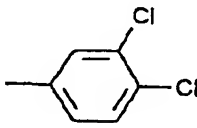
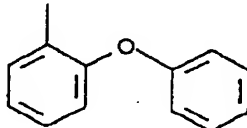
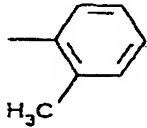
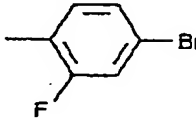
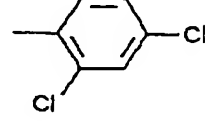
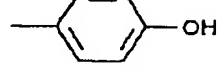
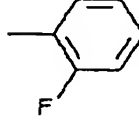
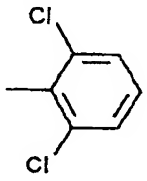
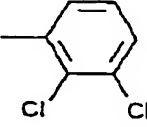
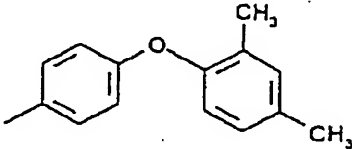
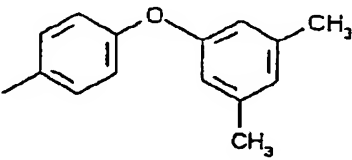
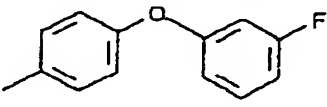
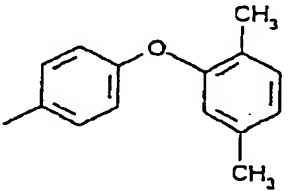
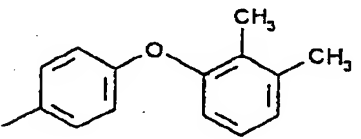
実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
142	H	-		logp.: 2.74
143	H	-		logp.: 2.98
144	H	-		logp.: 3.00
145	H	-		logp.: 2.66
146	H	-		logp.: 2.59
147	H	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 3.06
148	H	-		logp.: 1.30
149	H	-		logp.: 1.96

表 1 (続き)

実施例 番号	R ¹	A	R ²	物理データ
150	H	-		NMR [☆] : 12.43 (s, 1H)
151	H	-		logp.: 2.68
152	H	-		logp.: 3.76 m.p.: 155°C
153	H	-		logp.: 3.76 m.p.: 153°C
154	H	-		logp.: 3.18
155	H	-		logp.: 3.73
156	H	-		logp.: 3.66

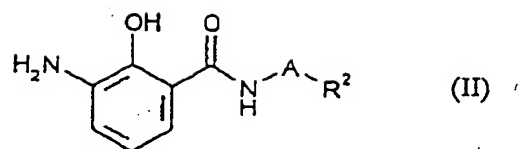
☆マスマスペクトル

☆☆¹H-NMRは、ジューテロクロロホルム(CDCI₃)またはヘキサジューテロジメチルスルフォキシド(DMSO-D₆)中で、テトラメチルシラン(TMS)を内部標準として用いて記録した。与えられたデータは、ppmでδ-値としての化学シフトである。

本発明の製造例(II-1)に準じて、ならびに以下の方法a-1 a) およびa-1 b) の一般的記載に従い得られる一般式(II)化合物は、以下の表2に掲げる

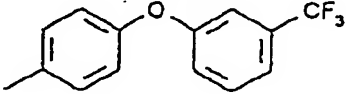
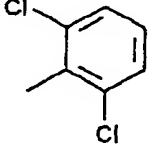
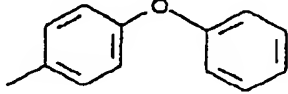
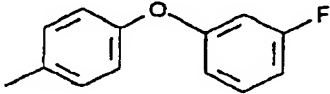
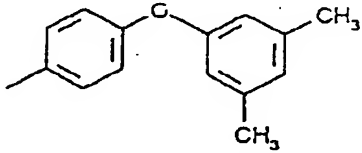
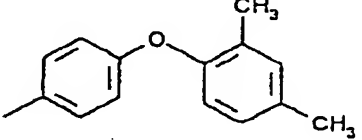
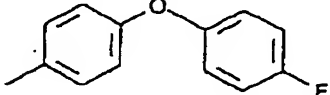
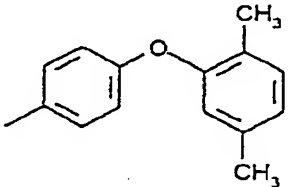
ものである：

表 2



実施例 番号	A	R ²	物理データ
(II-2)	-		NMR**: 6.73 - 7.99 (m, 10H) ppm
(II-3)	-		MS*: m/e = 277 (M ⁺)
(II-4)	-		MS*: m/e = 277 (M ⁺)
(II-5)	-		MS*: m/e = 296 (M ⁺)
(II-6)	-		HPLC***: R _f = 721

表 2 (続き)

実施例 番号	A	R ²	物理データ
(II-7)	-		HPLC***: R _f = 908
(II-8)	-		NMR**: 7.71 (s, 1H)
(II-9)	-		logp.: 2.70
(II-10)	-		logp.: 2.91
(II-11)	-		logp.: 3.55
(II-12)	-		logp.: 3.54
(II-13)	-		¹ H-NMR**: 6.65-9.05 (m, 12H)
(II-14)	-		logp.: 3.49

★マスマスペクトル

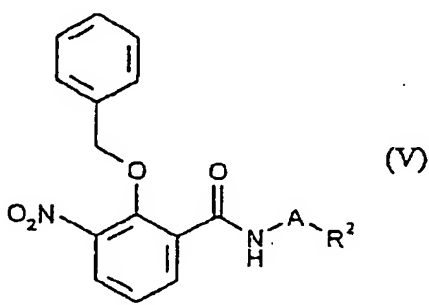
★★¹H-NMRは、ジューテロクロロホルム(CDCI₃)またはヘキサジューテロジメチルスルフォキシド(DMSO-D₆)中で、テトラメチルシラン(TMS)を内部標準として用いて記録した。与えられたデータは、ppmでδ-値としての化学シフトである。

★★★HPLC分析では、保持指数(R_f)はC₁₈逆相HPLCで、2-アルカノン(C-3-C-16

)に基づき、リン酸 (0.1%) / アセトニトリルの勾配系を使用して決定する。

本発明の製造例(V-1)に準じて、ならびに以下の方法 a-2) の一般的記載に従い得られる一般式 (V) 化合物は、以下の表 3 に掲げるものである：

表 3



(V)


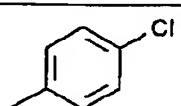

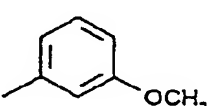

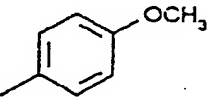

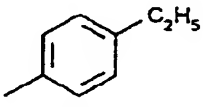
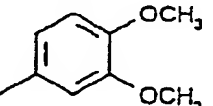
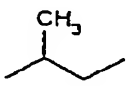
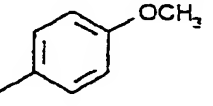
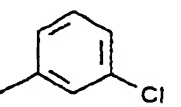

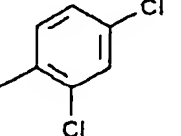
実施例 番号	A	R ²	物理データ
(V-2)			m.p.: 128°C
(V-3)			m.p.: 96°C
(V-4)			m.p.: 118°C
(V-5)			m.p.: 100°C
(V-6)	-CH ₂ -CH ₂ -		m.p.: 100°C
(V-7)			m.p.: 84°C
(V-8)	-CH ₂ -		m.p.: 95°C
(V-9)			m.p.: 128°C

表 3 (続き)

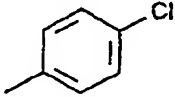
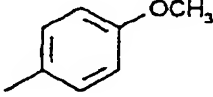
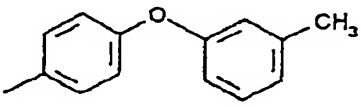
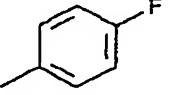
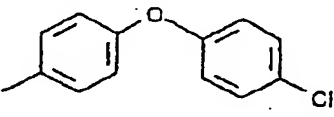
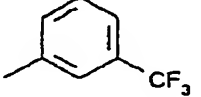
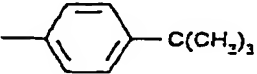
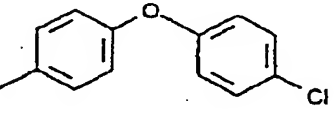
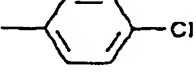

実施例 番号	A	R ²	物理データ
(V-10)	-		m.p.: 138°C
(V-11)	-CH ₂ -		m.p.: 114°C
(V-12)	-		logp.: 4.75
(V-13)	-CH ₂ -		m.p.: 138°C
(V-14)	-CH ₂ -CH ₂ -		m.p.: 119°C
(V-15)	-CH ₂ -		m.p.: 92°C
(V-16)	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 4.73
(V-17)	-CH ₂ -CH ₂ -		m.p.: 84°C
(V-18)	-CH ₂ -CH ₂ -		m.p.: 125°C
(V-19)	-CH ₂ -		m.p.: 146°C

表 3 (続き)


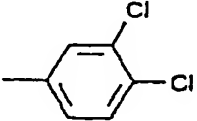
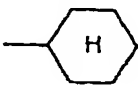

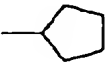
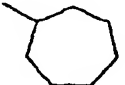
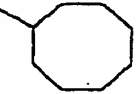
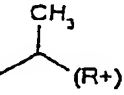

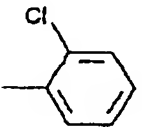
実施例 番号	A	R ²	物理データ
(V-20)	-CH ₂ -CH ₂ -		m.p.: 98°C
(V-21)	-CH ₂ -CH ₂ -		m.p.: 108°C
(V-22)	-		m.p.: 123°C
(V-23)	-		m.p.: 146°C
(V-24)	-		m.p.: 108°C
(V-25)	-		m.p.: 111°C
(V-26)	-		m.p.: 78°C
(V-27)	-	シクロデシル	m.p.: 130°C
(V-28)			logp.: 3.94
(V-29)	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 3.85

表 3 (続き)

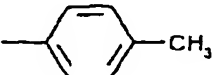
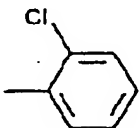
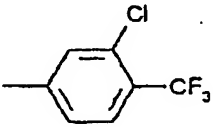
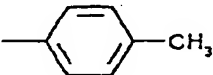

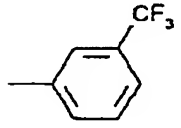

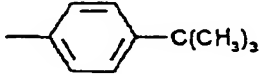

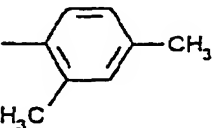

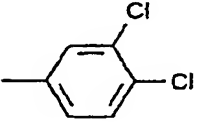
実施例 番号	A	R ²	物理データ
(V-30)	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 3.84
(V-31)	-CH ₂ -		logp.: 3.68
(V-32)	-CH ₂ -		logp.: 4.16
(V-33)	-CH ₂ -		logp.: 3.64
(V-34)			logp.: 4.04
(V-35)			logp.: 4.73
(V-36)			logp.: 4.19
(V-37)			logp.: 4.29

表 3 (続き)


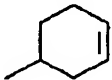
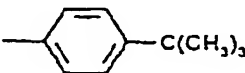

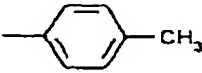

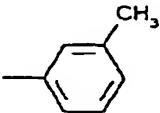
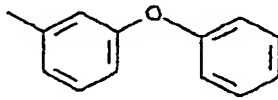
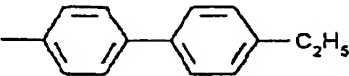

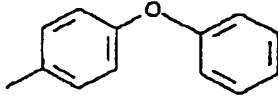

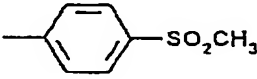

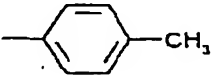
実施例 番号	A	R ²	物理データ
(V-38)			logp.: 3.96
(V-39)	-CH ₂ -		logp.: 4.53
(V-40)			m.p.: 111°C
(V-41)			logp.: 3.87
(V-42)	-CH ₂ -		logp.: 4.21
(V-43)	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 6.30
(V-44)			m.p.: 92°C
(V-45)			m.p.: 45°C
(V-46)			m.p.: 89°C

表 3 (続き)


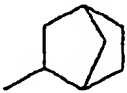
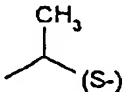
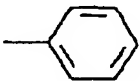

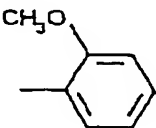

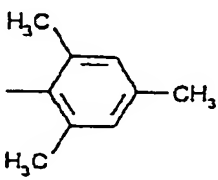
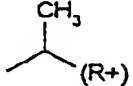
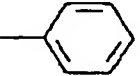
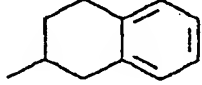
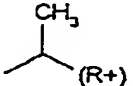
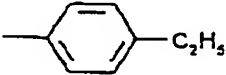
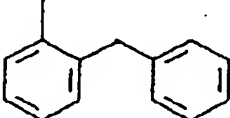
実施例 番号	A	R ²	物理データ
(V-47)			m.p.: 120°C
(V-48)			m.p.: 113°C
(V-49)			m.p.: 121°C
(V-50)			m.p.: 104°C
(V-51)			m.p.: 118°C
(V-52)	-		m.p.: 125°C
(V-53)			m.p.: 106°C
(V-54)	-		logp.: 4.37

表 3 (続き)


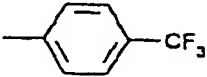
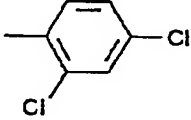
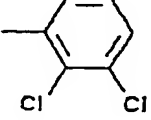
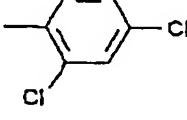
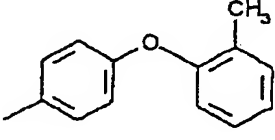
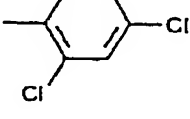
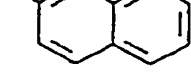
実施例 番号	A	R ²	物理データ
(V-55)	-		logp.: 3.55
(V-56)	-		logp.: 4.22
(V-57)	-CH ₂ -CH ₂ -		logp.: 4.37
(V-58)	-		logp.: 4.55
(V-59)	-CH ₂ -		logp.: 4.20
(V-60)	-		logp.: 4.77
(V-61)	-		logp.: 4.75
(V-62)	-		logp.: 3.88

表 3 (続き)

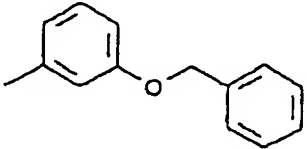
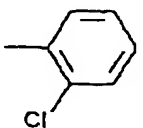
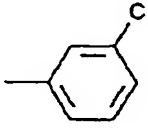
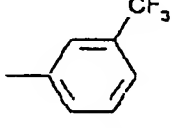
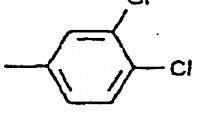
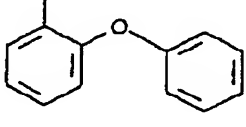
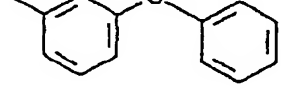
実施例 番号	A	R ²	物理データ
(V-63)	-		logp.: 4.32
(V-64)	-		logp.: 4.06
(V-65)	-		logp.: 4.03
(V-66)	-		logp.: 4.16
(V-67)	-		logp.: 4.50
(V-68)	-		logp.: 4.60
V-69)	-		logp.: 4.46

表 3 (続き)

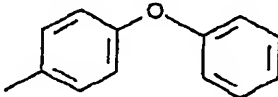
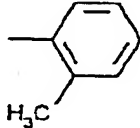
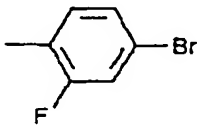
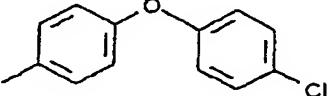
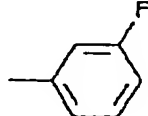
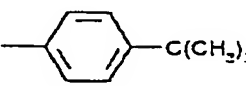
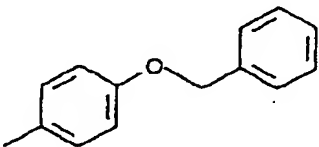
実施例 番号	A	R ²	物理データ
(V-70)	-		logp.: 4.42
(V-71)	-		logp.: 3.62
(V-72)	-		logp.: 4.33
(V-73)	-		logp.: 5.76
(V-74)	-		logp.: 3.68
(V-75)	-		logp.: 4.74
(V-76)	-		logp.: 4.32

表 3 (続き)

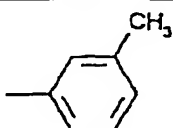
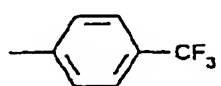
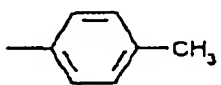
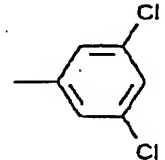
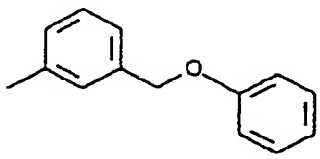
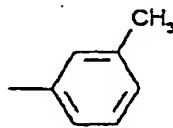
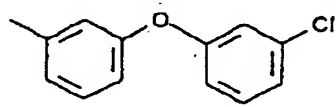
実施例 番号	A	R ²	物理データ
(V-77)	-CH ₂ -		logp.: 3.66
(V-78)	-CH ₂ -		logp.: 3.95
(V-79)	-		logp.: 3.82
(V-80)	-		logp.: 4.76
(V-81)	-		NMR*: 5.09 (s, 2H)
(V-82)	-		logp.: 4.41
(V-85)	-		logp.: 4.97

表 3 (続き)

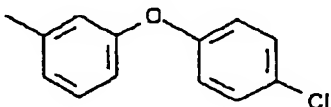
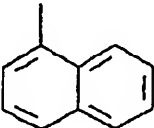
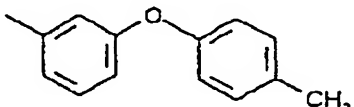
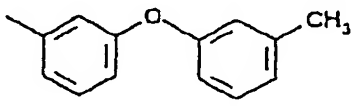
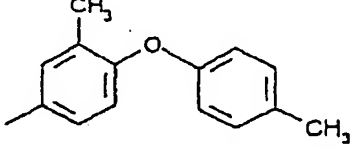
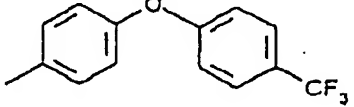
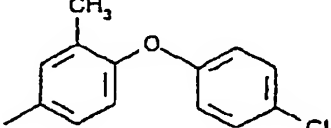
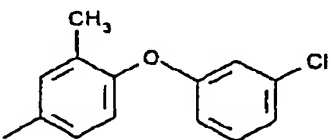
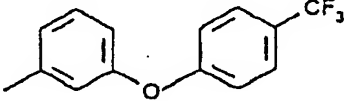
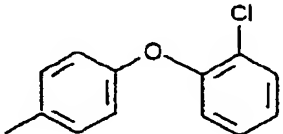
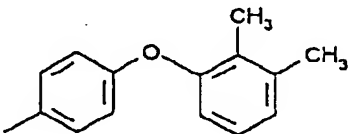
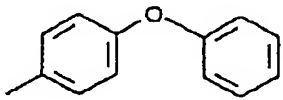
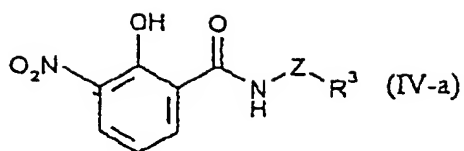
実施例 番号	A	R ²	物理データ
(V-84)	-		logp.: 4.93
(V-85)	-		logp.: 3.88
(V-86)	-		logp.: 4.81
(V-87)	-		logp.: 4.80
(V-88)	-		logp.: 5.13
(V-89)	-		logp.: 4.97
(V-90)	-		logp.: 5.26
(V-91)	-		logp.: 5.29

表 3 (続き)

実施例 番号	A	R ²	物理データ
(V-92)	-		logp.: 3.49
(V-93)	-		logp.: 4.62
(V-94)	-		logp.: 5.03
(V-95)	-		logp.: 4.41

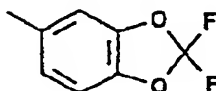
以下の表4に掲げる一般式(IV-a)の化合物は、本発明の製造例(IV-a-1)に準じて、ならびに以下の方法b-1)の一般的記載に従い得られる：

表 4

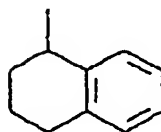


実施例 番号	Z	R ³	物理データ
IV-a-2	-	シクロドデシル	MS*: m/e = 348 (M ⁺)
IV-a-3	-	4-トリフルオロメトキシフェニル	MS*: m/e = 342 (M ⁺)
IV-a-4	-	3-トリフルオロメチルフェニル	MS*: m/e = 326 (M ⁺)
IV-a-5	-	4-トリフルオロメチルフェニル	MS*: m/e = 326 (M ⁺)
IV-a-6	-	2-トリフルオロメチルフェニル	MS*: m/e = 326 (M ⁺)
IV-a-7	-	4-ドデシルフェニル	IR: 1660 cm ⁻¹
IV-a-8	-	3-(ジフルオロクロロメトキシ)-フェニル	MS*: m/e = 358 (M ⁺)
IV-a-9	-	3,4-(ジフルオロメトキシ)-フェニル	MS*: m/e = 390 (M ⁺)
IV-a-10	-CH(CH ₃)-	フェニル	MS*: m/e = 272 (M ⁺ -15)
IV-a-11	-CH ₂ -	2-クロロフェニル	MS*: m/e = 306.5 (M ⁺)
IV-a-12	-CH ₂ -	2-フルオロフェニル	MS*: m/e = 272 (M ⁺ -18)
IV-a-13	-CH ₂ -	4-メチルフェニル	HPLC***: RF = 855
IV-a-14	-CH ₂ -	2,6-ジクロロフェニル	
IV-a-15	-CH ₂ -	4-メトキシフェニル	MS*: m/e = 302 (M ⁺)
IV-a-16	-CH ₂ -	4-クロロフェニル	MS*: m/e = 306 (M ⁺)

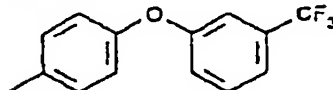
IV-a-17	-CH ₂ -	2,5-ジメチルフェニル	MS*: m/e = 300 (M ⁺)
IV-a-18	-CH ₂ -	4- <i>t</i> -ブチル-フェニル	MS*: m/e = 328 (M ⁺)
IV-a-19	-CH(CH ₃)-	4-クロロフェニル	MS*: m/e = 321 (M ⁺)
IV-a-20	-CH ₂ -	3-ピリジル	MS*: m/e = 273 (M ⁺)
IV-a-21	-CH ₂ -	2-ピリジル	MS*: m/e = 273 (M ⁺)
IV-a-22			MS*: m/e = 338 (M ⁺)



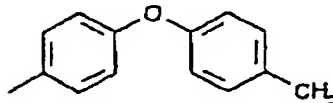
IV-a-23	-		MS*: m/e = 312 (M ⁺)
---------	---	--	----------------------------------



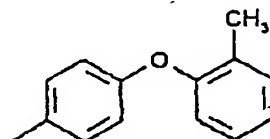
IV-a-24	-	3,5-ビストリフルオロメチル フェニル	MS*: m/e = 394 (M ⁺)
IV-a-25	-		logP.: 4.23



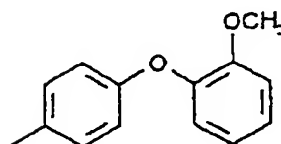
IV-a-26	-	4-フェニルフェニル	logP: 3.80
IV-a-27	-		logP: 4.06



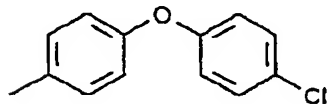
IV-a-28	-		logP: 4.04
---------	---	--	------------



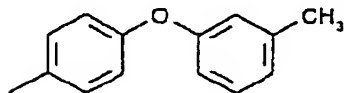
IV-a-29	-		MS*: m/e = 380 (M ⁺)
---------	---	--	----------------------------------



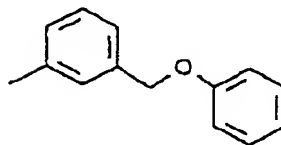
IV-a-30	-	2- ナフチル	logP: 3.33
IV-a-31	-	2- ベンジルフェニル	logP: 3.61
IV-a-32	-	3- ベンジルオキシフェニル	logP: 3.64
IV-a-33	-	2- フェノキシフェニル	logP: 4.60
IV-a-34	-	3- フェノキシフェニル	logP: 4.46
IV-a-35	-	4- フェノキシフェニル	logP: 4.42
IV-a-36	-	2,6-ジクロロフェニル	logP: 3.74
IV-a-37	-	4-ブロモ-2-フルオロフェニル	logP: 4.33
IV-a-38	-		logP: 4.21



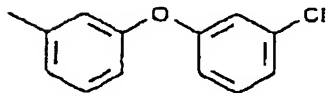
IV-a-39	-		logP: 4.30
---------	---	--	------------



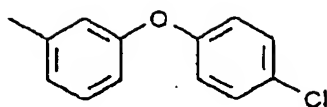
IV-a-40	-	4-t-ブチルフェニル	logP: 4.74
IV-a-41	-	4- ベンジルオキシフェニル	logP: 3.65
IV-a-42	-CH ₂ -	3-メチルフェニル	logP: 2.97
IV-a-43	-CH ₂ -	4- トリフルオロメチルフェニル	logP: 3.23
IV-a-44	-	4-トリフルオロメチルフェニル	logp: 3.39
IV-a-45	-	3,5- ジクロロフェニル	logP: 3.70
IV-a-46	-		¹ H-NMR**: δ = 12.5 ppm (s, 1H)



IV-a-47			logP: 4.25
---------	--	--	------------



IV-a-48



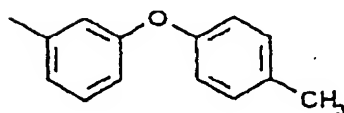
logP: 4.22

IV-a-49

α-ナフチル

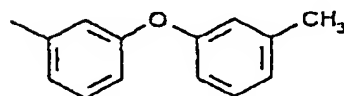
logP: 3.06

IV-a-50



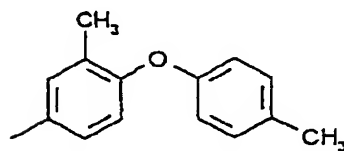
logP: 4.80

IV-a-51



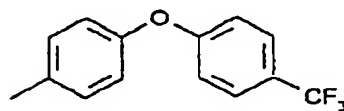
logP: 4.81

IV-a-52



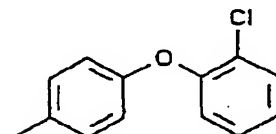
logP: 5.13

IV-a-53



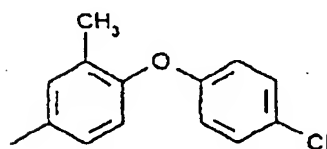
logP: 4.97

IV-a-54



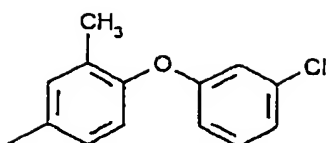
logP: 4.62

IV-a-55



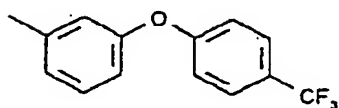
logP: 4.51

IV-a-56

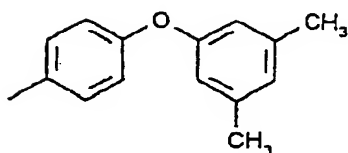


logP: 4.53

IV-a-57

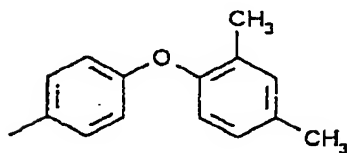

 $^1\text{H-NMR}^{**}: \delta = 12.4\text{ppm (s, 1H)}$

IV-a-58



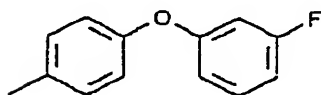
logP: 4.39

IV-a-59



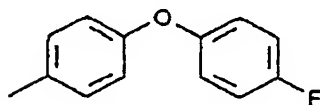
logP: 4.40

IV-a-60



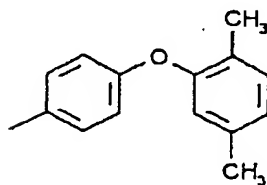
logP: 3.80

IV-a-61



logP: 3.72

IV-a-62



logP: 4.39

☆マスマスペクトル

☆☆ $^1\text{H-NMR}$ は、ジューテロクロホルム(CDCl_3)またはヘキサジューテロジメチルスルフォキシド(DMSO-D_6)中で、テトラメチルシラン(TMS)を内部標準として用いて記録した。与えられたデータは、ppmで δ -値としての化学シフトである。

☆☆☆HPLC分析では、保持指数(Rf)は、C₁₈逆相HPLCおよびリン酸(0.1%) / アセトニトリルの勾配系を使用して、2-アルカノン(C-3-C-16)に基づく。

使用例

実施例：A

セファエロセカ(Sphaerotheca)試験(キュウリ) / 保護性

溶媒：4.7重量部のアセトン

乳化剤：0.3重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および乳化剤と混合し、そして濃縮物を水で望ましい濃度に希釈する。

保護活性を試験するために、若い植物に活性化合物の調製物を噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した後、植物に菌類のセファエロセカ フリギネア(Sphaerotheca fuliginea)の分生子を散布する。

次に植物を23-24℃で約75%の相対大気湿度の温室に置く。

評価は接種の10日後に行う。

この試験では、100ppmの活性物質濃度で、例えば製造例の以下の(5)の化合物により、80%より高い効力が示される。

実施例：B

ベンチュリア(Venturia)試験(リンゴ) / 保護性

溶媒：4.7重量部のアセトン

乳化剤：0.3重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および乳化剤と混合し、そして濃縮物を水で望ましい濃度に希釈する。

保護活性を試験するために、若い植物に活性化合物の調製物を滴り落ちるまで噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した後、植物にリンゴ黒星病の病原菌であるベンチュリア イナエキュアリス(Venturia inaequalis)の分生子懸濁水を接種し、そして20℃で100%の相対大気湿度のインキューベーションキャビンに1日維持する。

次に植物を20℃で約70%の相対大気湿度の温室に置く。

評価は接種の12日後に行う。

この試験では、100ppmの活性物質濃度で、例えば製造例の以下の(2)、(4)、(5)、(12)および(15)の化合物により、80%より高い効力が示される。

実施例：C

ピリクラリア(Pyricularia)試験(イネ)／保護性

溶媒：12.5重量部のアセトン

乳化剤：0.3重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合し、そして濃縮物を水および上記量の乳化剤で望ましい濃度に希釈する。

保護活性を試験するために、若いイネの植物に活性化合物の調製物を滴り落ちるまで噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した4日後、植物にピリクラリアオリーゼ(Pyricularia oryzae)の孢子懸濁水を接種する。次に植物を100%の相対大気湿度で25℃の温室に置く。

病気の評価は、接種の4日後に行う。

この試験では、0.005%の活性物質濃度で、例えば製造例の以下の(5)の化合物により、80%より高い効力が示される。

実施例：D

シュードセルコスపోレーラ ヘルボトリコイデス(Pseudocercospora herpotrichoides)試験(小麦)／保護性

溶媒：10重量部のN-メチルピロリドン

乳化剤：0.6重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および乳化剤と混合し、そして濃縮物を水で望ましい濃度に希釈する。

保護活性を試験するために、若い植物に活性化合物の調製物を示した施用率で噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した後、植物の茎基(stembase)にシュードセルコスపోレーラ ヘルボトリコイデス(Pseudocercospora herpotrichoides)の孢子を接種する。

植物を、約10℃で約80%の相対大気湿度の温室に置く。

評価は、接種の21日後に行う。

この試験では、250g/haの活性化合物の施用率で、例えば製造例の以下の(5)の化合物により、80%より高い効力が示される。

実施例：E

フィトファソラ (Phytophthora) 試験 (トマト) / 保護性

溶媒：4.7重量部のアセトン

乳化剤：0.3重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および乳化剤と混合し、そして濃縮物を水で望ましい濃度に希釈する。

保護活性を試験するために、若い植物に活性化合物の調製物を露でぬれるまで噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した後、植物にフィトファソラ インフェスタンス (Phytophthora infestans) の孢子懸濁水を接種する。

植物を、約20℃で100%の相対大気湿度のインキュベーションキャビンに置く。

評価は、接種の3日後に行う。

この試験では、100ppmの活性化合物濃度で、例えば2、4、5、10、12および15の化合物により、80%より高い効力が示される。

実施例：F

プラスモパラ (Plasmopara) 試験 (ブドウの木) / 保護性

溶媒：4.7重量部のアセトン

乳化剤：0.3重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および乳化剤と混合し、そして濃縮物を水で望ましい濃度に希釈する。

保護活性を試験するために、若い植物に活性化合物の調製物を噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した後、植物にプラスモパラ ビチコーラ (P

lasmodora viticola) の孢子懸濁水を接種し、そして1日、20-22℃で100%の相

対大気湿度の湿潤チャンパーに維持する。次に植物を5日間、21℃で約90%の大気湿度の温室に置く。次に植物を湿らせ、そして湿潤チャンパーに1日置く。

評価は、接種の6日後に行う。

この試験では、100ppmの活性化化合物濃度で、例えば5、15および16の化合物により、90%より高い効力が示される。

実施例：G

ボトリチス(Botrytis)試験(マメ) / 保護性

溶媒：4.7重量部のアセトン

乳化剤：0.3重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化化合物を上記量の溶媒および乳化剤と混合し、そして濃縮物を水で望ましい濃度に希釈する。

保護活性を試験するために、若い植物に活性化化合物の調製物を噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した後、ボトリチス シネレア(Botrytis cinerea)で覆った2つの小さな寒天片を各葉の上に置く。接種した植物を、20℃で暗室中の湿潤チャンパーに置く。接種の3日後、葉上の傷の大きさを評価する。

この試験では、500ppmの活性化化合物濃度で、例えば2、3、4、5、10、12、15および16の化合物により、90%の効力が示される。

実施例：H

フェドン(Phaedon)の幼虫試験

溶媒：7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化化合物を上記量の溶媒および上記量の乳化剤と混合し、そして濃縮物を水で望ましい濃度に希釈する。

キャベツの葉(Brassica oleracea)を、望ましい濃度の活性化化合物の調製物に浸漬し、そしてマスタードビートル(mustard beetle)(Phaedon cochleariae)の幼虫を葉が湿っている間に群がらせる。

特定期間の後、撲滅を%で決定する。100%とは、すべての甲虫の幼虫が殺さ

れたことを意味し；0%は甲虫の幼虫が全く殺されなかったことを意味する。

この試験では、例えば7日後に0.01%の具体的な活性化合物濃度で、製造例（V-34）および（47）の化合物により100%の撲滅が示されたが、既知の化合物（A）は撲滅を示さなかった。

実施例：I

プルテラ (*Plutella*) 試験

溶媒：7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および上記量の乳化剤と混合し、そして濃縮物を水で望ましい濃度に希釈する。

キャベツの葉 (*Brassica oleracea*) を、望ましい濃度の活性化合物の調製物に浸漬して処理し、そしてコナガ (*Plutella maculipennis*) の幼虫を葉が湿っている間に群がらせる。

特定期間の後、撲滅を%で決定する。100%とは、すべての幼虫が殺

されたことを意味し；0%は幼虫が全く殺されなかったことを意味する。

この試験では、例えば7日後に0.01%の具体的な活性化合物濃度で、製造例（41）、（39）、（V-34）、（14）、（V-40）、（V-51）、（47）、（131）および（37）の化合物により80-100%の撲滅が示された。

実施例：J

スポドプテラ (*Spodoptera*) 試験

溶媒：7重量部の

乳化剤：1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および上記量の乳化剤と混合し、そして濃縮物を水で望ましい濃度に希釈する。

キャベツの葉 (*Brassica oleracea*) を、望ましい濃度の活性化合物の調製物に浸漬して処理し、そしてシロヤナガ (*Spodoptera frugiperda*) の幼虫を葉が湿っ

ている間に群がらせる。

特定期間の後、活性を%で決定する。100%とは、すべての幼虫が殺されたことを意味し；0%は幼虫が全く殺されなかったことを意味する。

この試験では、例えば7日後に0.1%の具体的な濃度で、以下の(47)の化合物により85%の撲滅が示される。

実施例：K

ネホテックス(Nephotettix)試験

溶媒：7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適当な調製物を作成するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒および上記量の乳化剤と混合し、そして濃縮物を水で望ましい濃度に希釈する。

イネの実生(*Oryza sativa*)を、望ましい濃度の活性化合物の調製物に浸漬して処理し、そしてツマグロヨコバイ(*Nephotettix cincticeps*)の幼虫を実生が湿っている間に群がらせる。

特定期間の後、撲滅を%で決定する。100%とは、すべてのヨコバイが殺されたことを意味し；0%はヨコバイが全く殺されなかったことを意味する。

この試験では、例えば7日後に0.001%の具体的な活性化合物濃度で、製造例(39)、(35)および(71)の化合物により100%の撲滅が引き起こされた。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No. PCT/EP 96/03637		
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 6 C07C237/44 C07C235/58 C07C235/64 C07C235/62 A01N37/18 A01N37/24		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 6 C07C		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES, vol. 52, no. 6, 1963, WASHINGTON US, pages 542-545, XP002020731 siehe Tabelle 1 und 2, Verbindung X see page 544, left-hand column, line 5 - line 16 see page 544, right-hand column, line 11 - line 29 --- -/--	1-5,7-9
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C. <input checked="" type="checkbox"/> Patent family members are listed in annex.		
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. "Z" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 10 December 1996		Date of mailing of the international search report 18.12.96
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5813 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax (+31-70) 340-1016		Authorized officer Seufert, G

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inter. Appl. Application No
PCT/EP 96/03637

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 122, no. 3, 16 January 1995 Columbus, Ohio, US; abstract no. 29879, SUZUKI, AKINORI ET AL.: "Pesticides TOD-4403 manufacture with streptomyces" page 792; XP002020733 siehe Zusammenfassung und 159812-89-2, 159698-61-0, 159698-60-9 & JP 06 239 844 A (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY) ---	1,2,7-9
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 119, no. 15, 11 October 1993 Columbus, Ohio, US; abstract no. 158366, IMAMARU, NOBUTAKA ET AL.: "Fungicidal urauchimycin A und B and their manufacture with streptomyces species" XP002020734 siehe Zusammenfassung und 148163-08-0, 148163-07-9 & JP 05 255 877 A (KAIYO BAI0 TEKUNOROJII KENKYUS) ---	1,2,7-9
X	BULLETIN OF THE CHEMICAL SOCIETY OF JAPAN, vol. 44, no. 12, 1971, TOKYO JP, pages 3395-9, XP002020732 MITSUHIRO KINOSHITA ET AL.: "Synthesis of (2S, 4R, 15S)-4,15-dimethyl-1,5-dioxa-3-(3'-formami dosalicylamido)cyclopentadecane-2,6-dione and its (15R)-epimer, new antimycin analogs" siehe Seite 3396, Verbindung 9a,9b, 10a,10b see page 3396, right-hand column, last paragraph - page 3397, left-hand column, line 2 --- -/--	1,2,7-9, 12

Form PCT/ISA/210 (continuation of record sheet) (July 1993)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Int. Appl. No.
PCT/EP 96/03637

C/(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 76, no. 1, 3 January 1972 Columbus, Ohio, US; abstract no. 1725, P. P. BATRA ET AL.: "Relation of structure and activity of antimycin A in the induction of carotenoid synthesis in mycobacterium marinum" page 169; XP002020735 siehe RN 34999-31-0, L-phenylalanine, N-[3-(formylamino)-2-hydroxybenzoyl]-, ethyl ester & J. BIOL. CHEM., vol. 246, no. 23, 1971, pages 7125-30. ---	2
X	JOURNAL OF CHROMATOGRAPHY, vol. 522, 1990, AMSTERDAM NL, pages 179-94, XP000611197 S. L. ABIDI ET AL.: "Liquid chromatography-thermospray mass spectrometric study of N-acylamino dilactones and 4-butyrolactones derived from antimycin A" see page 180 see page 181, last paragraph - page 182, line 6 ---	2.11
X	US 3 148 995 A (J. B. HEMWALL) 15 September 1964 see column 4, line 45 - line 46 ---	11
A	DE 21 26 149 A (FARBENWERKE BAYER) 7 December 1972 see claims; examples ---	1,7-9
A	US 3 929 879 A (TABORSKY ROBERT G) 30 December 1975 see column 3, line 40 - column 6, line 12; claims ---	7-9,13, 18
A	FR 1 501 151 A (STECKER INTERNATIONAL) 26 January 1968 see page 1, left-hand column, line 1-7; claims; table I see page 15, left-hand column, line 29 - line 31 -----	1,7-9

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (July 1992)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

Inventor and Application No
PCT/EP 96/03637

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US-A-3148995	15-09-64	NONE	
DE-A-2126149	07-12-72	NONE	
US-A-3929879	30-12-75	NONE	
FR-A-1501151	26-01-68	CH-A- 485843	15-02-70
		DE-A- 1593552	06-08-70
		GB-A- 1167734	22-10-69
		NL-A- 6616975	08-06-67
		US-A- 3455940	15-07-69

Form PCT/ISA/210 (patent family cases) (July 1992)

フロントページの続き

(51) Int. Cl. ⁶	識別記号	F I
C 0 7 C 237/38		C 0 7 C 237/38
237/40		237/40
317/40		317/40
C 0 7 D 213/40		C 0 7 D 213/40
307/81		307/81
317/66		317/66
333/20		333/20

(31) 優先権主張番号 1 9 6 2 6 3 1 1 . 5

(32) 優先日 1996年7月1日

(33) 優先権主張国 ドイツ (DE)

(81) 指定国 EP(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AU, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, HU, JP, KR, KZ, LK, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SK, TR, UA, US

(72) 発明者 テイーマン, ラルフ
ドイツ連邦共和国デー51375レーフェル
クーゼン・エルンストールトビヒーキル
ヒナーシュトラッセ5

(72) 発明者 シュテンツェル, クラウス
ドイツ連邦共和国デー40595デュツセル
ドルフ・ゼーゼナーシュトラッセ17

(72) 発明者 ヘンスラー, ゲルト
ドイツ連邦共和国デー51381レーフェル
クーゼン・アムアレンツベルク58アー

(72) 発明者 ドウツツマン, シュテファン
ドイツ連邦共和国デー40721ヒルデン
コーゼンベルク10